

**CRYSTAL OF TRICYCLIC FUSED HETEROCYCLIC COMPOUND**

**Patent number:** JP2001335576  
**Publication date:** 2001-12-04  
**Inventor:** ISHIHARA YUJI; DOI TAKAYUKI; ISHICHI YUJI  
**Applicant:** TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES LTD  
**Classification:**  
- **International:** C07D471/04; A61K31/437; A61K45/00; A61P13/00; A61P13/10; A61P25/28; A61P43/00  
- **European:**  
**Application number:** JP20010085190 20010323  
**Priority number(s):** JP20000088523 20000324; JP20010085190 20010323

Report a data error here

**Abstract of JP2001335576**

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To obtain the crystal of a stable tricyclic fused heterocyclic compound having an excellent inhibitory activity on acetylcholine esterase and ameliorating activity on bladder evacuation power. **SOLUTION:** This crystal is a crystal of 8-[3-[1-[(3-fluorophenyl)methyl]-4-piperidinyl]-1-oxopropyl]-1,2,5,6-tetrahydro-4H-pyrrolo[3,2,1-ij]quino lin-4-one or its salt. This medicine composition contains the crystal.

---

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2001-335576

(P2001-335576A)

(43) 公開日 平成13年12月4日 (2001.12.4)

(51) Int.Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	ページ数 (参考)
C 0 7 D 471/04	1 0 2	C 0 7 D 471/04	1 0 2 4 C 0 6 i
A 6 1 K 31/437		A 6 1 K 31/437	4 C 0 8 4
45/00		45/00	4 C 0 8 6
A 6 1 P 13/00		A 6 1 P 13/00	
13/10		13/10	

審査請求 未請求 請求項の数9 O L (全 50 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2001-85190 (P2001-85190)

(22) 出願日 平成13年3月23日 (2001.3.23)

(31) 優先権主張番号 特願2000-88523 (P2000-88523)

(32) 優先日 平成12年3月24日 (2000.3.24)

(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000002934

武田薬品工業株式会社

大阪府大阪市中央区道修町四丁目1番1号

(72) 発明者 石原 雄二

兵庫県伊丹市山田3丁目3番8号

(72) 発明者 土居 孝行

大阪府和泉市鶴山台1丁目10番地25号

(72) 発明者 石地 雄二

大阪府茨木市大正町1丁目1-210

(74) 代理人 100062144

弁理士 青山 稔 (外1名)

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 三環式縮合複素環誘導体の結晶

(57) 【要約】

【課題】 優れたアセチルコリンエステラーゼ阻害作用、膀胱排出力改善作用を有する安定な三環式縮合複素環誘導体の結晶の提供。

【解決手段】 8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-i j]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶およびそれを含有する医薬組成物。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶。

【請求項2】 融点が110℃以上である請求項1記載の結晶。

【請求項3】 融点が約113℃～約118℃である請求項1記載の結晶。

【請求項4】 請求項1記載の結晶を含有してなる医薬組成物。

【請求項5】 アセチルコリンエステラーゼ阻害剤である請求項4記載の医薬組成物。

【請求項6】 膀胱排出力改善剤である請求項4記載の医薬組成物。

【請求項7】 排尿障害治療剤である請求項4記載の医薬組成物。

【請求項8】 排尿困難治療剤である請求項4記載の医薬組成物。

【請求項9】 8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶と $\alpha$ 遮断剤とを組み合わせることを特徴とする膀胱排出力改善剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用、膀胱排出力改善作用を有する三環式縮合複素環誘導体の結晶、その結晶を含有してなる医薬組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンまたはその塩の無晶形の物質は、特開平7-206854号に記載されている。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】医薬産業上、吸収性が良く、安定なアセチルコリンエステラーゼ阻害剤、膀胱排出力改善剤および排尿障害・排尿困難治療剤の結晶が望まれている。

【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、鋭意検討した結果、高純度、高品質であり、吸湿性が低く、通常条件下で長期間保存しても変質せず、安定性に極めて優れた、8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-

1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンの結晶を得ることに成功し、本発明を完成した。すなわち、本発明は、(1)8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶、(2)融点が110℃以上である上記(1)記載の結晶、(3)融点が約113℃～約118℃である上記(1)記載の結晶、(4)上記(1)記載の結晶を含有してなる医薬組成物、(5)アセチルコリンエステラーゼ阻害剤である上記(4)記載の医薬組成物、(6)膀胱排出力改善剤である上記(4)記載の医薬組成物、(7)排尿障害治療剤である上記(4)記載の医薬組成物、(8)排尿困難治療剤である上記(4)記載の医薬組成物、(9)8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶と $\alpha$ 遮断剤とを組み合わせることを特徴とする膀胱排出力改善剤に関する。

【0005】(1)製造法

本発明の8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンの結晶(以下、「本発明の結晶」と略記することもある)は、8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンを自体公知の方法で結晶化することによって製造することができる。そのような結晶化の方法としては、例えば、溶液からの結晶化、蒸気からの結晶化、溶融体からの結晶化が挙げられる。該「溶液からの結晶化」の方法としては、例えば濃縮法、除冷法、反応法(拡散法、電解法)、水熱育成法、融剤法などが挙げられる。用いられる溶媒としては、例えば、芳香族炭化水素類(例、ベンゼン、トルエン、キシレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例、ジクロロメタン、クロロホルム等)、飽和炭化水素類(例、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等)、エーテル類(例、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等)、ニトリル類(例、アセトニトリル等)、ケトン類(例、アセトン等)、スルホキシド類(例、ジメチルスルホキシド等)、酸アミド類(例、N,N-ジメチルホルムアミド等)、エステル類(例、酢酸エチル等)、アルコール類(例、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等)、水などが用いられる。これらの溶媒は単独あるいは二種以上を適当な割合(例、1:1ないし1:100)で混合して用いられる。該「蒸気からの結晶

化」の方法としては、例えば気化法（封管法、気流法）、気相反応法、化学輸送法などが挙げられる。該「溶融体からの結晶化」の方法としては、例えばノルマルフリージング法（引上げ法、温度傾斜法、ブリッジマン法）、帯溶融法（ゾーンレベリング法、フロートゾーン法）、特殊成長法（VLS法、液相エピタキシー法）などが挙げられる。得られた結晶の解析方法としては、X線回折による結晶解析の方法が一般的である。さらに、結晶の方位を決定する方法としては、機械的な方法または光学的な方法なども挙げられる。

8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンまたはその塩の無晶形のものは、公知物質であり、例えば特開平7-206854号の明細書に記載した方法あるいはこれに準ずる方法により製造することができる。これを上記の結晶化法に適用することで本発明の結晶が得られる。

#### 【0006】(2) 塩

8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ビペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンの塩としては、薬理学的に許容される塩が好ましく、例えば無機酸との塩、有機酸との塩などが挙げられる。無機酸との塩の好適な例としては、例えば塩酸、臭化水素酸、硝酸、硫酸、リン酸などとの塩が挙げられる。有機酸との塩の好適な例としては、例えばギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、シュウ酸、酒石酸、マレイン酸、クエン酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸などとの塩が挙げられる。

#### 【0007】(3) 結晶の性質

本発明の結晶としては、例えば110℃以上の融点を有し、粉末X線結晶回折により、面間隔(d値)約17.4、約8.68、約5.27、約4.97、約4.76、約4.31、約3.85オングストロームに特徴的ピークを有する回折パターンを示すものなどが挙げられる。好ましくは、例えば約113℃～約118℃の融点を有し、粉末X線結晶回折により、面間隔(d値)約17.4、約8.68、約5.27、約4.97、約4.76、約4.31、約3.85オングストロームに特徴的ピークを有する回折パターンを示すものである。本発明の結晶は、高純度（純度99.9%）、高品質であり、吸湿性が低く、通常条件下で長期間保存しても変質せず、安定性に極めて優れている。

#### 【0008】(4) 処方

本発明の結晶は、毒性が低く、そのまま、または薬理学的に許容し得る担体などと混合して医薬組成物とすることにより、哺乳動物（例、ヒト、マウス、ラット、ウサギ、イヌ、ネコ、ウシ、ウマ、ブタ、サル等）に対し、後述する各種疾患の予防・治療剤として用いること

ができる。ここにおいて、薬理学的に許容される担体としては、製剤素材として慣用の各種有機あるいは無機担体物質が用いられ、固形製剤における賦形剤、滑沢剤、結合剤、崩壊剤；液状製剤における溶剤、溶解補助剤、懸濁化剤、等張化剤、緩衝剤、無痛化剤などとして配合される。また必要に応じて、防腐剤、抗酸化剤、着色剤、甘味剤などの製剤添加物を用いることもできる。賦形剤の好適な例としては、例えば乳糖、白糖、D-マンニトール、D-ソルビトール、デンプン、 $\alpha$ 化デンプン、デキストリン、結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、アラビアゴム、デキストリン、プルラン、軽質無水ケイ酸、合成ケイ酸アルミニウム、メタケイ酸アルミン酸マグネシウムなどが挙げられる。滑沢剤の好適な例としては、例えばステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、タルク、コロイドシリカなどが挙げられる。結合剤の好適な例としては、例えば $\alpha$ 化デンプン、ショ糖、ゼラチン、アラビアゴム、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、結晶セルロース、白糖、D-マンニトール、トレハロース、デキストリン、プルラン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドンなどが挙げられる。崩壊剤の好適な例としては、例えば乳糖、白糖、デンプン、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム、クロスカルメロースナトリウム、カルボキシメチルスターチナトリウム、軽質無水ケイ酸、低置換度ヒドロキシプロピルセルロースなどが挙げられる。

【0009】溶剤の好適な例としては、例えば注射用水、生理的食塩水、リンゲル液、アルコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ゴマ油、トウモロコシ油、オリーブ油、綿実油などが挙げられる。溶解補助剤の好適な例としては、例えばポリエチレングリコール、プロピレングリコール、D-マンニトール、トレハロース、安息香酸ベンジル、エタノール、トリスアミノメタン、コレステロール、トリエタノールアミン、炭酸ナトリウム、クエン酸ナトリウム、サリチル酸ナトリウム、酢酸ナトリウムなどが挙げられる。懸濁化剤の好適な例としては、例えばステアリルトリエタノールアミン、ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリルアミノプロピオン酸、レシチン、塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウム、モノステアリン酸グリセリンなどの界面活性剤；例えばポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、カルボキシメチルセルロースナトリウム、メチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロースなどの親水性高分子；ポリソルベート類、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油などが挙げられる。等張化剤の好適な例としては、例えば塩化ナトリウム、グリセリン、D-マン

ニトール、D-ソルビトール、ブドウ糖などが挙げられる。緩衝剤の好適な例としては、例えばリン酸塩、酢酸塩、炭酸塩、クエン酸塩などの緩衝液などが挙げられる。無痛化剤の好適な例としては、例えばベンジルアルコールなどが挙げられる。

【0010】防腐剤の好適な例としては、例えばパラオキシ安息香酸エステル類、クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェネチルアルコール、デヒドロ酢酸、ソルビン酸などが挙げられる。抗酸化剤の好適な例としては、例えば亜硫酸塩、アスコルビン酸塩などが挙げられる。着色剤の好適な例としては、例えば水溶性食用タール色素（例、食用赤色2号および3号、食用黄色4号および5号、食用青色1号および2号などの食用色素、水不溶性レーキ色素（例、上記水溶性食用タール色素のアルミニウム塩など）、天然色素（例、 $\beta$ -カロチン、クロロフィル、ベンガラなど）などが挙げられる。甘味剤の好適な例としては、例えばサッカリンナトリウム、グリチルリチン二カリウム、アスパルテーム、ステビアなどが挙げられる。

#### 【0011】(5) 投与形態

医薬組成物の剤形としては、例えば錠剤、カプセル剤（ソフトカプセル、マイクロカプセルを含む）、顆粒剤、散剤、シロップ剤、乳剤、懸濁剤などの経口剤；および注射剤（例、皮下注射剤、静脈内注射剤、筋肉内注射剤、腹腔内注射剤など）、外用剤（例、経鼻投与製剤、経皮製剤、軟膏剤など）、坐剤（例、直腸坐剤、膣坐剤など）、ペレット、点滴剤等の非経口剤が挙げられ、これらはそれぞれ経口的あるいは非経口的に安全に投与できる。医薬組成物は、製剤技術分野において慣用の方法、例えば日本薬局方に記載の方法等により製造することができる。以下に、製剤の具体的な製造法について詳述する。

【0012】例えば、経口剤は、有効成分に、例えば賦形剤（例、乳糖、白糖、デンプン、D-マンニトールなど）、崩壊剤（例、カルボキシメチルセルロースカルシウムなど）、結合剤（例、 $\alpha$ 化デンプン、アラビアゴム、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルピロリドンなど）または滑沢剤（例、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ポリエチレングリコール6000など）などを添加して圧縮成形し、次いで必要により、味のマスキング、腸溶性あるいは持続性を目的として、コーティング基剤を用いて自体公知の方法でコーティングすることにより製造される。該コーティング基剤としては、例えば糖衣基剤、水溶性フィルムコーティング基剤、腸溶性フィルムコーティング基剤、徐放性フィルムコーティング基剤などが挙げられる。糖衣基剤としては、白糖が用いられ、さらに、タルク、沈降炭酸カルシウム、ゼラチン、アラビアゴム、プルラン、カルナバロウなどから選ばれる1種または2種以上を併用してもよい。水溶性フィルムコーティング

基剤としては、例えばヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、メチルヒドロキシエチルセルロースなどのセルロース系高分子；ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート、アミノアルキルメタアクリレートコポリマーE〔オイドラギットE（商品名）、ロームファルマ社〕、ポリビニルピロリドンなどの合成高分子；プルランなどの多糖類などが挙げられる。腸溶性フィルムコーティング基剤としては、例えばヒドロキシプロピルメチルセルロース フタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロース アセテートサクシネート、カルボキシメチルエチルセルロース、酢酸フタル酸セルロースなどのセルロース系高分子；メタアクリル酸コポリマーL〔オイドラギットL（商品名）、ロームファルマ社〕、メタアクリル酸コポリマーLD〔オイドラギットL-30D55（商品名）、ロームファルマ社〕、メタアクリル酸コポリマーS〔オイドラギットS（商品名）、ロームファルマ社〕などのアクリル酸系高分子；セラックなどの天然物などが挙げられる。徐放性フィルムコーティング基剤としては、例えばエチルセルロースなどのセルロース系高分子；アミノアルキルメタアクリレートコポリマーRS〔オイドラギットRS（商品名）、ロームファルマ社〕、アクリル酸エチル・メタアクリル酸メチル共重合体懸濁液〔オイドラギットNE（商品名）、ロームファルマ社〕などのアクリル酸系高分子などが挙げられる。上記したコーティング基剤は、その2種以上を適宜の割合で混合して用いてもよい。また、コーティングの際に、例えば酸化チタン、三酸化鉄等のような遮光剤を用いてもよい。注射剤は、有効成分を分散剤（例、ポリソルベート80、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油60など）、ポリエチレングリコール、カルボキシメチルセルロース、アルギン酸ナトリウムなど）、保存剤（例、メチルパラベン、プロピルパラベン、ベンジルアルコール、クロロブタノール、フェノールなど）、等張化剤（例、塩化ナトリウム、グリセリン、D-マンニトール、D-ソルビトール、ブドウ糖など）などと共に水性溶剤（例、蒸留水、生理的食塩水、リンゲル液等）あるいは油性溶剤（例、オリーブ油、ゴマ油、綿実油、トウモロコシ油などの植物油、プロピレングリコール等）などに溶解、懸濁あるいは乳化することにより製造される。この際、所望により溶解補助剤（例、サリチル酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等）、安定剤（例、ヒト血清アルブミン等）、無痛化剤（例、ベンジルアルコール等）等の添加剤を用いてもよい。

#### 【0013】(6) 治療される疾患

本発明の結晶はアセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する。したがって、本発明の結晶および本発明の医薬組成物は、老年期痴呆症の予防・治療剤として用いることができる。また、本発明の結晶および本発明の医薬組成物は、例えば膀胱排出力改善剤として用いることがで

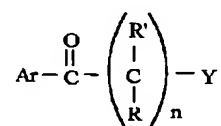
きる。例えば、以下の1)から6)等に起因する排尿障害、特に排尿困難の予防・治療剤として用いることができる。1)前立腺肥大症、2)膀胱頸部閉鎖症、3)神経因性膀胱、4)糖尿病、5)手術、6)低緊張性膀胱、および7)シェーグレン症候群(ドライアイ、ドライマウス、瞳乾燥等)。より具体的には、前立腺肥大による低緊張膀胱、糖尿病による低緊張膀胱、糖尿病性神経障害による低緊張膀胱、特発性低緊張膀胱(加齢によるものを含む)、多発性硬化症による低緊張膀胱、パーキンソン病による低緊張膀胱、脊髄損傷による低緊張膀胱、手術後の低緊張膀胱、脳閉塞による低緊張膀胱、糖尿病による神経因性膀胱、糖尿病性神経障害による神経因性膀胱、多発性硬化症による神経因性膀胱、パーキンソン病による神経因性膀胱、脊髄損傷による神経因性膀胱、脳閉塞による神経因性膀胱などによる排尿困難の予防・治療剤として用いることができる。さらに、本発明の結晶および本発明の医薬組成物は、頻尿、尿失禁等の排尿障害の予防・治療剤としても用いることができる。

#### 【0014】(7)他の剤との組み合わせ利用

本発明の結晶は、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物の一種である。本発明の結晶を含む、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物類と、排尿障害(例えば、排尿困難等)を引き起こす疾患を治療する薬剤もしくは他の疾患治療のために投与されるがそれ自体が排尿障害(例えば、排尿困難等)を惹起する薬剤とを組み合わせ用いることができる。そのような「アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物」としては、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有し、分子内にカルバメート構造(—OCON—)を有さず、アンモニアの水素原子を炭化水素基で置換した化合物であればよく、好ましくは、第一アミン化合物、第二アミン化合物、第三アミン化合物である。さらに好ましくは、以下に記載する1)~49)の化合物等が列記される。これらの化合物のうち、少なくとも1個の5ないし7員含窒素複素環を部分構造として有する化合物等が好ましく、中でも後述の1)、20)、23)、41)、42)および43)の化合物等が好ましく、1)の化合物等が特に好ましい。

#### 【0015】1)式

##### 【化1】



(式中、Arは縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい、nは1ないし10の整数、RおよびR'はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子または置換基を有していてもよい炭化水素基、Yは

置換基を有していてもよいアミノ基または置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基を示す。)で表される化合物(以下、化合物(I)と略記することもある)またはその塩。

【0016】上記式中、Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」の「置換基」としては、例えば、(i)ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(ii)ハロゲン原子(例えば、フルオロ、クロル、ブロム、ヨード等)、(iii)低級アルキレンジオキシ基(例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ等のC<sub>1</sub>-<sub>3</sub>アルキレンジオキシ基等)、(iv)ニトロ基、(v)シアノ基、(vi)ヒドロキシ基、(vii)ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii)シクロアルキル基(例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等のC<sub>3</sub>-<sub>6</sub>シクロアルキル基等)、(ix)ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(x)アミノ基、(xi)モノ-低級アルキルアミノ基(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ-C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルアミノ基等)、(xii)ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ-C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルアミノ基等)、(xiii)5ないし7員環状アミノ基(例えば、1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基(例、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等)等)、(xiv)低級アルキル-カルボニルアミノ基(例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等のC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xv)低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、プロピルスルホニルアミノ等のC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基等)、(xvi)低級アルコキシ-カルボニル基(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソブトキシカルボニル等のC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ-カルボニル基等)、(xvii)カルボキシ基、(xviii)低級アルキル-カルボニル基(例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、ブチルカルボニル等のC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル-カルボニル基等)、(xix)シクロアルキル-カルボニル基(例えば、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル等のC<sub>3</sub>-<sub>6</sub>シクロアルキル-カルボニル基等)、(xx)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xxi)モノ-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、プロピルカルバモイル、ブチルカルバモイル等のモノ-C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル-カルバモイル基等)、(xxii)ジ-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、ジエチルカルバモイル、ジブチル

カルバモイル等のジ- $C_1-6$  アルキル-カルバモイル基等)、(xxiii) 低級アルキルスルホニル基(例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等の $C_1-6$  アルキルスルホニル基等)、(xxiv) シクロアルキルスルホニル基(例えば、シクロペンチルスルホニル、シクロヘキシルスルホニル等の $C_3-6$  シクロアルキルスルホニル等)、(xxv) フェニル基、(xxvi) ナフチル基、(xxvii) モノ-フェニル-低級アルキル基(例えばベンジル、フェニルエチル等のモノ-フェニル- $C_1-6$  アルキル基等)、(xxviii) ジ-フェニル-低級アルキル基(例えば、ジフェニルメチル、ジフェニルエチル等のジ-フェニル- $C_1-6$  アルキル基等)、(xxix) モノ-フェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基(例えばフェニルメチルカルボニルオキシ、フェニルエチルカルボニルオキシ等のモノ-フェニル- $C_1-6$  アルキル-カルボニルオキシ基等)、(xxx) ジ-フェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基(例えば、ジフェニルメチルカルボニルオキシ、ジフェニルエチルカルボニルオキシ等のジ-フェニル- $C_1-6$  アルキル-カルボニルオキシ基等)、(xxxi) フェノキシ基、(xxxii) モノ-フェニル-低級アルキル-カルボニル基(例えばフェニルメチルカルボニル、フェニルエチルカルボニル等のモノ-フェニル- $C_1-6$  アルキル-カルボニル基等)、(xxxiii) ジ-フェニル-低級アルキル-カルボニル基(例えば、ジフェニルメチルカルボニル、ジフェニルエチルカルボニル等のジ-フェニル- $C_1-6$  アルキル-カルボニル基等)、(xxxiv) ベンゾイル基、(xxxv) フェノキシカルボニル基、(xxxvi) フェニル-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、フェニル-メチルカルバモイル、フェニル-エチルカルバモイル等のフェニル- $C_1-6$  アルキル-カルバモイル基等)、(xxxvii) フェニルカルバモイル基、(xxxviii) フェニル-低級アルキル-カルボニルアミノ基(例えば、フェニル-メチルカルボニルアミノ、フェニル-エチルカルボニルアミノ等のフェニル- $C_1-6$  アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xxxix) フェニル-低級アルキルアミノ基(例えば、フェニル-メチルアミノ、フェニル-エチルアミノ等のフェニル- $C_1-6$  アルキルアミノ基等)、(xxxx) フェニル-低級アルキルスルホニル基(例えば、フェニル-メチルスルホニル、フェニル-エチルスルホニル等のフェニル- $C_1-6$  アルキルスルホニル基等)、(xxxxi) フェニルスルホニル基、(xxxxii) フェニル-低級アルキルスルフィニル基(例えば、フェニル-メチルスルフィニル、フェニル-エチルスルフィニル等のフェニル- $C_1-6$  アルキルスルフィニル基等)、(xxxxiii) フェニル-低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、フェニル-メチルスルホニルアミノ、フェニル-エチルスルホニルアミノ等のフェニル- $C_1-6$  アルキルスルホニルアミノ基等)および(xxxxiv) フェニルスル

ホニルアミノ基(上記(xxxv) ないし(xxxxiv) のフェニル基、ナフチル基、モノ-フェニル-低級アルキル基、ジ-フェニル-低級アルキル基、モノ-フェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基、ジ-フェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基、フェノキシ基、モノ-フェニル-低級アルキル-カルボニル基、ジ-フェニル-低級アルキル-カルボニル基、ベンゾイル基、フェノキシカルボニル基、フェニル-低級アルキル-カルバモイル基、フェニルカルバモイル基、フェニル-低級アルキル-カルボニルアミノ基、フェニル-低級アルキルアミノ基、フェニル-低級アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、フェニル-低級アルキルスルフィニル基、フェニル-低級アルキルスルホニルアミノ基およびフェニルスルホニルアミノ基は、さらに、例えば、低級アルキル基(例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル等の $C_1-6$  アルキル等)、低級アルコキシ基(例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ等の $C_1-6$  アルコキシ等)、ハロゲン原子(例えば、クロル、ブロム、ヨード等)、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基、アミノ基、モノ-低級アルキルアミノ基(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ- $C_1-6$  アルキルアミノ等)、ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ- $C_1-6$  アルキルアミノ等)、ニトロ基、低級アルキル-カルボニル基(例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、ブチルカルボニル等の $C_1-6$  アルキル-カルボニル等)、ベンゾイル基等から選ばれた1ないし4個の置換基を有していてもよい。)等が挙げられる。該フェニル基はこれらの置換基を1ないし4個有していてもよい。

【0017】上記の「ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基」としては、例えば、1ないし3個のハロゲン原子(例えば、クロル、ブロム、ヨード等)を有していてもよい低級アルキル基(例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル等の $C_1-6$  アルキル基等)等が挙げられ、具体例としては、メチル、クロロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、エチル、2-ブromoエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、プロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、イソプロピル、ブチル、4, 4, 4-トリフルオロブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、5, 5, 5-トリフルオロペンチル、ヘキシル、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル等が挙げられる。上記の「ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基」としては、例えば、1ないし3個のハロゲン原子(例えば、クロル、ブロム、ヨード等)を有していてもよい低級アルコ



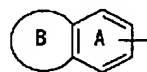
キシ基（例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ等の $C_1 - 6$ アルコキシ基等）等が挙げられ、具体例としては、例えばメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、エトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、4, 4, 4-トリフルオロブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等が挙げられる。上記の「ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基」としては、例えば、1ないし3個のハロゲン原子（例えば、クロル、ブロム、ヨード等）を有していてもよい低級アルキルチオ基（例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ等の $C_1 - 6$ アルキルチオ基等）等が挙げられ、具体例としては、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、4, 4, 4-トリフルオロブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ等が挙げられる。

【0018】「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」の「置換基」として好ましくは、(i) アミノ基、(ii) モノ-低級アルキルアミノ基（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ- $C_1 - 6$ アルキルアミノ基等）、(iii) ジ-低級アルキルアミノ基（例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ- $C_1 - 6$ アルキルアミノ基等）、(iv) 例えば1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基（例えば、ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、チオモルホリン等）、(v) 低級アルキル-カルボニルアミノ基（例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等の $C_1 - 6$ アルキル-カルボニルアミノ基等）、(vi) 低級アルキルスルホニルアミノ基（例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、プロピルスルホニルアミノ等の $C_1 - 6$ アルキルスルホニルアミノ基等）、(vii) フェニル-低級アルキルアミノ（例えば、フェニル-メチルアミノ、フェニル-エチルアミノ等のフェニル- $C_1 - 6$ アルキルアミノ等）、(viii) フェニル-低級アルキルスルホニルアミノ基（例えば、フェニル-メチルスルホニルアミノ、フェニル-エチルスルホニルアミノ等のフェニル- $C_1 - 6$ アルキル-スルホニルアミノ基等）、(ix) フェニルスルホニルアミノ基、(x) ハロゲン原子（例えば、フルオロ、クロル等）、(xi) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基（例えば、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、トリフルオロメチル等）および(xii) ハロゲン化されてい

てもよい低級アルコキシ基（例えば、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、tert-ブトキシ、トリフルオロメトキシ等）等が挙げられ、特に、ジ-低級アルキルアミノ基（例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ- $C_1 - 6$ アルキルアミノ基等）、1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基（例えば、ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、チオモルホリン等）等が好ましい。該「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」の「フェニル基」が縮合する例としては、例えば、(1) 置換基を有していてもよい単環式複素環と縮合する場合、(2) 置換基を有していてもよい2環式複素環と縮合する、あるいは2つの同一または異なる単環（但し、少なくとも一方の環が単環式複素環である）と縮合する場合、および(3) 置換基を有していてもよい3環式複素環と縮合する場合等が挙げられる。

【0019】上記(1)の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」のフェニル基が単環式複素環と縮合する場合の具体例としては、例えば、式

【化2】



〔式中、A環は置換基を有していてもよいベンゼン環、およびB環は置換基を有していてもよい複素環を示す。〕で表される基等が挙げられる。A環の置換基としては、上記の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」の「置換基」等が挙げられ、その置換基数は1ないし3個である。

【0020】B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「複素環」としては、例えば、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む4ないし14員（好ましくは5ないし9員）芳香族または非芳香族複素環等が挙げられる。具体的には例えば、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、イミダゾール、フラン、チオフェン、ジヒドロピリジン、ジアゼピン、オキサゼピン、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン、ピロール、ピラゾール、1, 2, 3-トリアゾール、オキサゾール、オキサゾリジン、チアゾール、チアゾリジン、イソオキサゾール、イミダゾリン等が挙げられる。このうち、1個のヘテロ原子あるいは同一または異なる2個のヘテロ原子を含有する5ないし9員環の非芳香族複素環（例えば、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピ

ペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン等)等が好ましい。特に、①例えば窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる1個のヘテロ原子を含有する非芳香族複素環、②1個の窒素原子と窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる1個のヘテロ原子とを含有する非芳香族複素環等が好ましい。B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」としては、例えば(i)ハロゲン原子(例えば、フルオロ、クロル、ブロム、ヨード等)、(ii)ニトロ基、(iii)シアノ基、(iv)オキシ基、(v)ヒドロキシ基、(vi)低級アルキル基(例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル等の $C_{1-6}$ アルキル基等)(vii)低級アルコキシ基(例えば、メトキシ、エトキシ、プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、ブチルオキシ等の $C_{1-6}$ アルコキシ基等)、(viii)低級アルキルチオ基(例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ等の $C_{1-6}$ アルキルチオ基等)、(ix)アミノ基、(x)モノ-低級アルキルアミノ基(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基等)、(xi)ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基等)、(xii)例えば炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基(例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等)、(xiii)低級アルキル-カルボニルアミノ基(例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等の $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xiv)低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ等の $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xv)低級アルコキシ-カルボニル基(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル等の $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基等)、(xvi)カルボキシ基、(xvii)低級アルキルカルボニル基(例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル等の $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基等)、(xviii)カルバモイル基、(xix)モノ-低級アルキルカルバモイル基(例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル等のモノ- $C_{1-6}$ アルキル-カルバモイル基等)、(xx)ジ-低級アルキルカルバモイル基(例えば、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル等のジ- $C_{1-6}$ アルキル-カルバモイル基等)、(xxi)低級アルキルスルホニル基(例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等の $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基等)等から選ばれた1ないし5個が用いられる。中でも、オキシ基、低級アルキル基(例えば、

メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル等の $C_{1-6}$ アルキル基等)等が好ましい。特にオキシ基等が好ましい。

【0021】B環が環中に窒素原子を有する場合、例えば、B環は環中に式

$>N-R^1$

〔式中、 $R^1$ は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、アシル基または置換基を有していてもよい複素環基を示す。〕で表される基を有していてもよい。さらに、B環は上記置換基(i)ないし(xxi)を1ないし3個有していてもよい。 $R^1$ で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「炭化水素基」は、炭化水素化合物から水素原子を1個除いた基を示し、その例としては、例えば以下のアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、アリール基、アラールキル基、これらの組み合わせの基等が挙げられる。このうち、 $C_{1-16}$ 炭化水素基等が好ましい。

(1)アルキル基(例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル、ペンチル、ヘキシル等の $C_{1-6}$ アルキル基等)

(2)アルケニル基(例えば、ビニル、アリル、イソプロペニル、ブテニル、イソブテニル、sec-ブテニル等の $C_{2-6}$ アルケニル基等)

(3)アルキニル基(例えば、プロパルギル、エチニル、ブチニル、1-ヘキシニル等の $C_{2-6}$ アルキニル基等)

(4)シクロアルキル基(例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の $C_{3-6}$ シクロアルキル基等)

(5)架橋環式低級飽和炭化水素基(例えば、ビスクロ〔3.2.1〕オクト-2-イル、ビスクロ〔3.3.1〕ノン-2-イル、アダマンタン-1-イル等の架橋環式 $C_{8-14}$ 飽和炭化水素基等)

(6)アリール基(例えば、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、ビフェニル、2-インデニル、2-アンスリル等の $C_{6-14}$ アリール基等、好ましくはフェニル基等)

(7)アラールキル基(例えば、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル、フェニルブチル、フェニルペンチル、フェニルヘキシル等のフェニル- $C_{1-10}$ アルキル； $\alpha$ -ナフチルメチル等のナフチル- $C_{1-6}$ アルキル；ジフェニルメチル、ジフェニルエチル等のジフェニル- $C_{1-3}$ アルキル等の $C_{7-16}$ アラールキル基等)

(8)アリール-アルケニル基(例えばスチリル、シンナミル、4-フェニル-2-ブテニル、4-フェニル-3-ブテニル等のフェニル- $C_{2-12}$ アルケニル等の $C_{6-14}$ アリール- $C_{2-12}$ アルケニル基等)

(9)アリール- $C_{2-12}$ アルキニル基(例えば、フ

フェニルエチニル、3-フェニル-2-プロピニル、3-フェニル-1-プロピニル等のフェニル- $C_{2-12}$ アルキニル等の $C_{6-14}$ アリール- $C_{2-12}$ アルキニル基等)

(10) シクロアルキル-アルキル基(例えば、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘプチルメチル、シクロオクチルメチル、シクロノニルメチル、シクロデシルメチル、シクロペンチルエチル、シクロブチルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘプチルエチル、シクロオクチルエチル、シクロノニルエチル、シクロデシルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロブチルプロピル、シクロペンチルプロピル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘプチルプロピル、シクロオクチルプロピル、シクロノニルプロピル、シクロデシルプロピル、シクロペンチルブチル、シクロブチルブチル、シクロペンチルブチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘプチルブチル、シクロオクチルブチル、シクロノニルブチル、シクロデシルブチル、シクロペンチルペンチル、シクロブチルペンチル、シクロペンチルペンチル、シクロヘキシルペンチル、シクロヘプチルペンチル、シクロオクチルペンチル、シクロノニルペンチル、シクロデシルペンチル、シクロペンチルヘキシル、シクロブチルヘキシル、シクロペンチルヘキシル、シクロヘキシルヘキシル等の $C_{3-7}$ シクロアルキル- $C_{1-6}$ アルキル基等)

(11) アリール-アリール- $C_{1-10}$ アルキル基(例えばビフェニルメチル、ビフェニルエチル等)

【0022】 $R^1$ で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「炭化水素基」の好ましいものとしては、例えば、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、 $C_{7-16}$ アラールキル基等である。さらに好ましくは $C_{7-10}$ アラールキル基(例えば、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル等のフェニル- $C_{1-4}$ アルキル等)等である。 $R^1$ で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「置換基」としては、例えば、(i) ハロゲン原子(例えば、フルオロ、クロル、ブロム、ヨード等)、(ii) ニトロ基、(iii) シアノ基、(iv) オキソ基、(v) ヒドロキシ基、(vi) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(vii) ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii) ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix) アミノ基、(x) モノ-低級アルキルアミノ基(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基等)、(xi) ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基等)、(xii) 例えば炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子および硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基(例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等)、(xiii) 低級アルキル-カルボニルアミノ基(例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等の $C_{1-6}$ アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xiv) 低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ等の $C_{1-6}$ アルキル-

スルホニルアミノ基等)、(xv) 低級アルコキシ-カルボニル基(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル等の $C_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基等)、(xvi) カルボキシ基、(xvii) 低級アルキル-カルボニル基(例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル等の $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル基等)、(xviii) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xix) モノ-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル等のモノ- $C_{1-6}$ アルキル-カルバモイル基等)、(xx) ジ-低級アルキル-カルバモイル基(例えば、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル等のジ- $C_{1-6}$ アルキル-カルバモイル基等)、(xxi) 低級アルキルスルホニル基(例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等の $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基等)、(xxii) 低級アルコキシ-カルボニル-低級アルキル基(例えば、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、tert-ブトキシカルボニルメチル、メトキシカルボニルエチル、メトキシカルボニルメチル、メトキシカルボニル(ジメチル)メチル、エトキシカルボニル(ジメチル)メチル、tert-ブトキシカルボニル(ジメチル)メチル等の $C_{1-6}$ アルキル-カルボニル- $C_{1-6}$ アルキル基等)、(xxiii) カルボキシ-低級アルキル基(例えば、カルボキシルメチル、カルボキシルエチル、カルボキシル(ジメチル)メチル等のカルボキシ- $C_{1-6}$ アルキル基等)、(xxiv) 置換基を有していてもよい複素環基、(xxv)  $C_{6-14}$ アリール基(例えば、フェニル、ナフチル等)、(xxvi)  $C_{7-16}$ アラールキル基(例えば、ベンジル等)、(xxvii) 置換基を有していてもよいウレイド基(例えば、ウレイド、3-メチルウレイド、3-エチルウレイド、3-フェニルウレイド、3-(4-フルオロフェニル)ウレイド、3-(2-メチルフェニル)ウレイド、3-(4-メトキシフェニル)ウレイド、3-(2, 4-ジフルオロフェニル)ウレイド、3-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]ウレイド、3-ベンジルウレイド、3-(1-ナフチル)ウレイド、3-(2-ビフェニル)ウレイド等)、(xxviii) 置換基を有していてもよいチオウレイド基(例えば、チオウレイド、3-メチルチオウレイド、3-エチルチオウレイド、3-フェニルチオウレイド、3-(4-フルオロフェニル)チオウレイド、3-(4-メチルフェニル)チオウレイド、3-(4-メトキシフェニル)チオウレイド、3-(2, 4-ジクロロフェニル)チオウレイド、3-ベンジルチオウレイド、3-(1-ナフチル)チオウレイド等)、(xxix) 置換基を有していてもよいアミジノ基(例えば、アミジノ、 $N^1$ -メチルアミジノ、 $N^1$ -エチルアミジノ、 $N^1$ -フェニルアミジノ、 $N^1$ ,  $N^1$ -ジメチルアミジノ、 $N^1$ ,  $N^2$ -ジメチルアミジノ、 $N^1$ -メ

チル-N<sup>1</sup>-エチルアミノ、N<sup>1</sup>、N<sup>1</sup>-ジエチルアミノ、N<sup>1</sup>-メチル-N<sup>1</sup>-フェニルアミノ、N<sup>1</sup>、N<sup>1</sup>-ジ(4-ニトロフェニル)アミノ等)、(xxx)置換基を有していてもよいグアニジノ基(例えば、グアニジノ、3-メチルグアニジノ、3,3-ジメチルグアニジノ、3,3-ジエチルグアニジノ等)、(xxxi)置換基を有していてもよい環状アミノカルボニル基(例えば、ピロリジノカルボニル、ピペリジノカルボニル、(4-メチルピペリジノ)カルボニル、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル、(4-メチルピペラジノ)カルボニル、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]カルボニル、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル、モルホリノカルボニル、チオモルホリノカルボニル等)、(xxxii)置換基を有していてもよいアミノチオカルボニル基(例えば、アミノチオカルボニル、メチルアミノチオカルボニル、ジメチルアミノチオカルボニル等)、(xxxiii)置換基を有していてもよいアミノスルホニル基(例えば、アミノスルホニル、メチルアミノスルホニル、ジメチルアミノスルホニル等)、(xxxiv)置換基を有していてもよいフェニルスルホニルアミノ(例えば、フェニルスルホニルアミノ、(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ、(2,5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ、(4-メトキシフェニル)スルホニルアミノ、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニルアミノ、(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ等)、(xxxv)スルホ基、(xxxvi)スルフィノ基、(xxxvii)スルフェノ基、(xxxviii)C<sub>1</sub>-6アルキルスルホ基(例えば、メチルスルホ、エチルスルホ、プロピルスルホ等)、(xxxix)C<sub>1</sub>-6アルキルスルフィノ基(例えば、メチルスルフィノ、エチルスルフィノ、プロピルスルフィノ等)、(xxxx)C<sub>1</sub>-6アルキルスルフェノ基(例えば、メチルスルフェノ、エチルスルフェノ、プロピルスルフェノ等)、(xxxxi)ホスホ基、(xxxxii)ジ-C<sub>1</sub>-6アルコキシホスホリル基(例えば、ジメトキシホスホリル、ジエトキシホスホリル、ジプロポキシホスホリル等)等から選ばれた1ないし5個(好ましくは1ないし3個)が挙げられる。このうち好ましくは、ハロゲン原子、ハロゲン化されていてもよいアルキル基、ハロゲン化されていてもよいアルコキシ基、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、カルボキシ基、C<sub>1</sub>-6アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、アミノチオカルボニル基、モノ-C<sub>1</sub>-6アルキルカルバモイル基、ジ-C<sub>1</sub>-6アルキルカルバモイル基、アミノ基、モノ-C<sub>1</sub>-6アルキルアミノ基、ジ-C<sub>1</sub>-6アルキルアミノ基、5ないし7員環状アミノ基、C<sub>1</sub>-6

アルキルカルボニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、C<sub>1</sub>-6アルキルスルホニルアミノ基等が挙げられる。

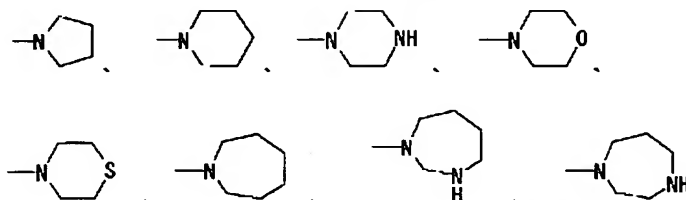
【0023】上記「置換基を有していてもよい複素環基」の「複素環基」としては、例えば、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子1ないし6個(好ましくは1ないし4個)を含む5ないし14員(単環式または2ないし4環式)複素環から水素原子を1個除去してできる基等が用いられる。単環式複素環基としては、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、イミダゾール、フラン、チオフェン、ジヒドロピリジン、ジアゼピン、オキサゼピン、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン、ピロール、ピラゾール、1,2,3-トリアゾール、オキサゾール、オキサゾリジン、チアゾール、チアゾリジン、イソオキサゾール、イミダゾリン、トリアゾール、チアジアゾール、オキサジアゾール、オキサチアジアゾール、トリアジン、テトラゾール等の単環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。2環式複素環としては、例えば、インドール、ジヒドロインドール、イソインドール、ジヒドロイソインドール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンズイミダゾール、ベンズオキサゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンズチアゾール、インダゾール、キノリン、テトラヒドロキノリン、イソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、テトラヒドロ-1H-1-ベンズアゼピン、テトラヒドロ-1H-2-ベンズアゼピン、テトラヒドロ-1H-3-ベンズアゼピン、テトラヒドロベンズオキサゼピン、キナゾリン、テトラヒドロキナゾリン、キノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンズチアジン、イミダゾピリジン等の2環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が用いられる。3または4環式複素環基としては、アクリジン、テトラヒドロアクリジン、ピロロキノリン、ピロロインドール、シクロペントインドール、イソインドロベンズアゼピン等の3または4環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。

【0024】該「複素環基」としては、単環または2環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が好ましい。該「置換基を有していてもよい複素環基」の「置換基」としては上記B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」が挙げられ、その置換基数は1ないし5個である。R<sup>1</sup>で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」として好ましくは、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-6アルキル、C<sub>1</sub>-6アルコキシ、ニトロ、シアノおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいC<sub>7-16</sub>アラルキル基(好ましくはベンジル等)等が挙げられる。上記R<sup>1</sup>で示さ

れる「アシル基」としては、例えば、式： $-(C=O)-R^2$ 、 $-(C=O)-OR^2$ 、 $-(C=O)-NR^2$ 、 $-(C=O)-R^2$ 、 $-(C=O)-OR^2$ 、 $-(C=O)-NR^2$ 、 $-(C=S)-OR^2$  または  $-(C=S)NR^2$   $R^3$ 〔式中、 $R^2$  および  $R^3$  はそれぞれ (i) 水素原子、(ii) 置換基を有していてもよい炭化水素基または (iii) 置換基を有していてもよい複素環基を示すか、 $R^2$  と  $R^3$  とは互いに結合して隣接する窒素原子と共に置換基を有していてもよい含窒素環基を形成してもよい。〕で表されるアシル基等が挙げられる。このうち好ましくは、式： $-(C=O)-R^2$  または  $-(C=O)-NR^2$   $R^3$ 〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表されるアシル基である。

【0025】 $R^2$  または  $R^3$  で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」および「置換基を有していてもよい複素環基」は、上記  $R^1$  で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」および「置換基を有していてもよい複素環基」と同様のものがそれぞれ挙げられる。 $R^2$  と  $R^3$  とで形成される「置換基を有していてもよい含窒素環基」としては、炭素原子および1個の窒素原子以外に、例えば窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよい5ないし9員（好ましくは5ないし7員）の含窒素飽和複素環基等が挙げられる。より具体的には、例えば、式

【化3】

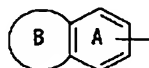


で表される基等が挙げられる。

【0026】該「置換基を有していてもよい含窒素環基」の「置換基」としては、上記B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」と同様のものが挙げられ、その置換基数は1ないし5個である。R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> として、好ましくは、(i) 水素原子、(ii) ハロゲン化されていてもよいC<sub>1-6</sub> アルキル、(iii) C<sub>1-6</sub> アルキルおよびC<sub>1-6</sub> アルコキシから選ばれる置換基を1ないし3個有していてもよいC<sub>6-10</sub> アリール、(iv) C<sub>7-16</sub> アラルキル（例、ベンジル等）、(v) 5または6員複素環基（例、ピリジル、チエニル、フリル等）等が挙げられる。上記R<sup>1</sup> で示される「アシル基」として、好ましくは、ホルミル、ハロゲン化されていてもよいC<sub>1-6</sub> アルキル-カルボニル（例、アセチル、トリフルオロアセチル、プロピオニル等）、5または6員複素環カルボニル（例、ピリジルカルボニル、チエニルカルボニル、フリルカルボニル等）、C<sub>6-14</sub> アリール-カルボニル（例、ベンゾイル、1-ナフトイル、2-ナフトイル等）、C<sub>7-16</sub> アラルキル-カルボニル（例、フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル等）、C<sub>6-10</sub> アリールスルホニル（例、ベンゼンスルホニル、ナフチルスルホニル等）等が挙げられる。R<sup>1</sup> は、好ましくは、水素原子、C<sub>1-6</sub> アルキル、C<sub>1-6</sub> アルキル-カルボニル、C<sub>6-14</sub> アリール-カルボニル等である。

【0027】上記式

【化4】

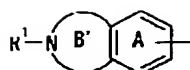


で表される基の具体例としては、2, 3-ジヒドロベンゾフラン; 3, 4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾチオピラン; 2, 3-ジヒドロ-1H-インドール; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン; 2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1-ベンズアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-2-ベンズアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-3-ベンズアゼピン等のベンズアゼピン; 1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-1-ベンズアゾシン、1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-2-ベンズアゾシン、1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-3-ベンズアゾシン等のベンズアゾシン; 2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-1-ベンズアゾニン、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-2-ベンズアゾニン、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-3-ベンズアゾニン、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-4-ベンズアゾニン等のベンズアゾニン; 2, 3-ジヒドロベンズオキサゾール等のベンズオキサゾール; 2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール等のベンゾチアゾール; 2, 3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール等のベンズイミダゾール; 3, 4-ジヒドロ-1H-2, 1-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 2-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 3-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-3, 1-ベンズオキサジン等のベンズオキサジン; 3, 4-ジヒドロ-1H-2, 1-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 2-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-2H-

1, 4-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 3-ベンゾチアジン、3, 4-ジヒドロ-2H-3, 1-ベンゾチアジン等のベンゾチアジン; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロシンノリン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロフタラジン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリン等のベンゾジアジン; 3, 4-ジヒドロ-1, 2-ベンズオキサチン、3, 4-ジヒドロ-2, 1-ベンズオキサチン、2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンズオキサチン、1, 4-ジヒドロ-2, 3-ベンズオキサチン、4H-1, 3-ベンズオキサチン、4H-3, 1-ベンズオキサチン等のベンズオキサチン; 3, 4-ジヒドロ-1, 2-ベンゾジオキシシ、2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシシ、1, 4-ジヒドロ-2, 3-ベンゾジオキシシ、4H-1, 3-ベンゾジオキシシ等のベンゾジオキシシ; 3, 4-ジヒドロ-1, 2-ベンズジチン、2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンズジチン、1, 4-ジヒドロ-2, 3-ベンズジチン、4H-1, 3-ベンズジチン等のベンズジチン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 2-ベンズオキサゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 3-ベンズオキサゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 4-ベンズオキサゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 5-ベンズオキサゼピン、1, 3, 4, 5-テトラヒドロ-2, 1-ベンズオキサゼピン、1, 3, 4, 5-テトラヒドロ-2, 3-ベンズオキサゼピン、1, 3, 4, 5-テトラヒドロ-2, 4-ベンズオキサゼピン、1, 2, 4, 5-テトラヒドロ-3, 1-ベンズオキサゼピン、1, 2, 4, 5-テトラヒドロ-3, 2-ベンズオキサゼピン、1, 2, 3, 5-テトラヒドロ-4, 1-ベンズオキサゼピン等のベンズオキサゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 2-ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 4-ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 5-ベンゾチアゼピン、1, 3, 4, 5-テトラヒドロ-2, 1-ベンゾチアゼピン、1, 3, 4, 5-テトラヒドロ-2, 4-ベンゾチアゼピン、1, 2, 4, 5-テトラヒドロ-3, 1-ベンゾチアゼピン、1, 2, 4, 5-テトラヒドロ-3, 2-ベンゾチアゼピン、1, 2, 3, 5-テトラヒドロ-4, 1-ベンゾチアゼピン等のベンゾチアゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 2-ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 3-ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 4-ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 5-ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-2, 3-ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-2, 4-ベンゾチアゼピン等のベンゾチアゼピン; 4, 5-ジヒドロ-1, 3-ベンゾジオキセピン、4, 5-ジヒドロ-3H-1, 2,

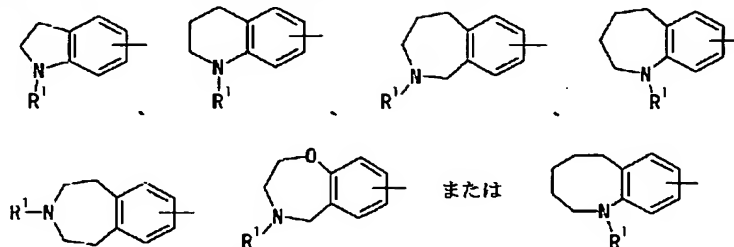
ベンゾジオキセピン、2, 3-ジヒドロ-5H-1, 4-ベンゾジオキセピン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾジオキセピン、4, 5-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンゾジオキセピン、1, 5-ジヒドロ-2, 4-ベンゾジオキセピン等のベンゾジオキセピン; 4, 5-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンゾチエピン、1, 5-ジヒドロ-2, 4-ベンゾジチエピン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾジチエピン、2, 3-ジヒドロ-5H-1, 4-ベンゾジチエピン等のベンゾジチエピン、3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 5-ベンゾオキサゾシン、3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 6-ベンゾオキサゾシン等のベンゾオキサゾシン; 3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 5-ベンゾチアゾシン、3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 6-ベンゾチアゾシン等のベンゾチアゾシン; 1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-1, 6-ベンゾジアゾシン等のベンゾジアゾシン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 6-ベンゾオキサチオシン等のベンゾオキサチオシン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 6-ベンゾジオキソシン等のベンゾジオキソシン; 1, 3, 5-ベンゾトリオキセピン、5H-1, 3, 4-ベンゾトリオキセピン等のベンゾトリオキセピン; 3, 4-ジヒドロ-1H-5, 2, 1-ベンゾオキサチアゼピン、3, 4-ジヒドロ-2H-5, 1, 2-ベンゾオキサチアゼピン、4, 5-ジヒドロ-3, 1, 4-ベンゾオキサチアゼピン、4, 5-ジヒドロ-3H-1, 2, 5-ベンゾオキサチアゼピン等のベンゾオキサチアゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 3, 4-ベンゾオキサジアゼピン等のベンゾオキサジアゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 3, 5-ベンゾチアジアゼピン等のベンゾチアジアゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 2, 5-ベンゾトリアゼピン等のベンゾトリアゼピン; 4, 5-ジヒドロ-1, 3, 2-ベンゾオキサチエピン、4, 5-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンゾオキサチエピン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾオキサチエピン、4, 5-ジヒドロ-3H-1, 2-ベンゾオキサチエピン、4, 5-ジヒドロ-3H-2, 1-ベンゾオキサチエピン、2, 3-ジヒドロ-5H-1, 4-ベンゾオキサチエピン、2, 3-ジヒドロ-5H-4, 1-ベンゾオキサチエピン等、とりわけ2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-2-ベンゾアゼピン、2, 3-ジヒドロ-1H-インドール、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 4-ベンゾオキサゼピン等の2環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。

【0028】このうち、好ましい例としては式【化5】



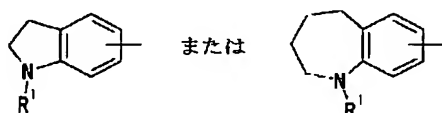
〔式中、B'環はオキシ基でさらに置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環、その他の各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基等が挙げられる。

【0029】該「オキシ基でさらに置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」の「5ないし9員の含窒素複素環」としては、炭素原子および1個の窒素原子



〔式中、R¹は上記と同意義を示す。〕で表される基等が挙げられる。特に好ましくは、式

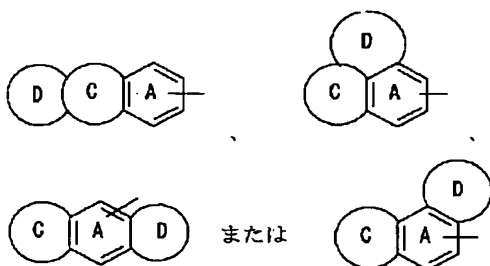
【化7】



〔式中、R¹は上記と同意義を示す。〕で表される基等が挙げられる。

【0030】上記(2)の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」のフェニル基が置換基を有していてもよい2環式複素環と縮合する、あるいは2つの同一または異なった単環(但し、少なくとも一方の環が単環式複素環である)と縮合する場合の具体例としては、例えば、式

【化8】



〔式中、A環は上記と同意義、C環およびD環の一方は置換基を有していてもよい複素環、他方は置換基を有していてもよい5ないし9員環を示す。〕で表される基等が挙げられる。

【0031】C環またはD環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「複素環」としては、B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」が挙げられる。C環またはD環で示される「置換基を有していてもよい5ないし9員環」の「5ないし9員環」は、窒素原

子以外に、例えば窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよい5ないし9員の含窒素複素環等が挙げられ、5ないし9員の非芳香族含窒素複素環(例えば、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン等)等が好ましく用いられる。このうち、より好ましい例としては、式

【化6】

子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよく、例えば、5ないし9員複素環(例えば、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、イミダゾール、フラン、チオフェン、ジヒドロピリジン、ジアゼピン、オキサゼピン、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン等)、5ないし9員炭素環(例えば、ベンゼン、シクロペンタン、シクロペンテン、シクロヘキサン、シクロヘキセン、シクロヘキサジエン、シクロヘプタン、シクロヘプテン、シクロヘプタジエン等)等が挙げられる。このうち、5ないし7員環が好ましい。中でも、ベンゼン、シクロヘキサン等が好ましい。「置換基を有していてもよい5ないし9員環」の「置換基」としては、上記B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」と同様のものが挙げられる。

【0032】上記式

【化9】

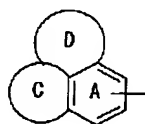


〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、カルバゾール、1, 2, 3, 4, 4a, 9a-ヘキサヒドロカルバゾール、9, 10-ジヒドロアクリジン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロアクリジン、10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ〔b, f〕アゼピン、5, 6, 7, 12-テトラヒドロジベンズ〔b, g〕アゾシン、6, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ〔b, e〕アゼピン、6, 7-ジヒドロ-5H-ジベンズ〔c, e〕アゼピン、5, 6, 11, 12-テトラヒドロジベンズ〔b, f〕アゾシン、ジベンゾフラン、9H-キサンテン、10, 11-ジヒドロジベンズ

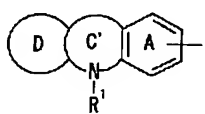
〔b, f〕オキセピン、6, 11-ジヒドロジベンズ  
 〔b, e〕オキセピン、6, 7-ジヒドロ-5H-ジベンズ  
 〔b, g〕オキソシン、ジベンズチオフェン、9H-  
 チオキサンテン、10, 11-ジヒドロジベンズ  
 〔b, f〕チエピン、6, 11-ジヒドロジベンズ  
 〔b, e〕チエピン、6, 7-ジヒドロ-5H-ジベンズ  
 〔b, g〕チオシン、10H-フェノチアジン、10H-  
 フェノキサジン、5, 10-ジヒドロフェナジン、  
 10, 11-ジベンズ〔b, f〕〔1, 4〕チアゼピン、  
 10, 11-ジヒドロジベンズ〔b, f〕〔1, 4〕  
 オキサゼピン、2, 3, 5, 6, 11, 11a-ヘキサ  
 ヒドロ-1H-ピロロ〔2, 1-b〕〔3〕ベンズア  
 ゼピン、10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ  
 〔b, e〕〔1, 4〕ジアゼピン、5, 11-ジヒドロ  
 ジベンズ〔b, e〕〔1, 4〕オキサゼピン、5, 11-  
 ジヒドロジベンズ〔b, f〕〔1, 4〕チアゼピン、  
 10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ〔b, e〕  
 〔1, 4〕ジアゼピン、1, 2, 3, 3a, 8, 8a-  
 ヘキサヒドロピロロ〔2, 3-b〕インドール等の3環  
 式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基  
 が挙げられる。

【0033】上記式

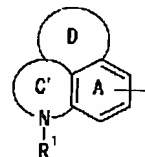
【化10】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基  
 の具体例としては、1H, 3H-ナフト〔1, 8-c  
 d〕〔1, 2〕オキサジン、ナフト〔1, 8-de〕-  
 1, 3-オキサジン、ナフト〔1, 8-de〕-1, 2-  
 オキサジン、1, 2, 2a, 3, 4, 5-ヘキサヒド  
 ロベンズ〔cd〕インドール、2, 3, 3a, 4, 5,  
 6-ヘキサヒドロ-1H-ベンズ〔de〕キノリン、4  
 H-ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン、1, 2,  
 5, 6-テトラヒドロ-4H-ピロロ〔3, 2, 1-  
 ij〕キノリン、5, 6-ジヒドロ-4H-ピロロ〔3,  
 2, 1-ij〕キノリン、1H, 5H-ベンズ〔ij〕

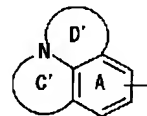


または



〔式中、C'環およびD'環は、それぞれオキソ基でさら  
 に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環、  
 その他の各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基  
 等が好ましい。このうち式

【化14】

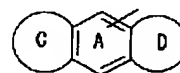


〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基

キノリジン、アゼピノ〔3, 2, 1-hi〕インドー  
 ル、1, 2, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロアゼピノ  
 〔3, 2, 1-hi〕インドール、1H-ピリド〔3,  
 2, 1-jk〕〔1〕ベンズアゼピン、5, 6, 7, 8-  
 テトラヒドロ-1H-ピリド〔3, 2, 1-jk〕  
 〔1〕ベンズアゼピン、1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキ  
 サヒドロ-1H-ピリド〔3, 2, 1-jk〕〔1〕ベン  
 ズアゼピン、2, 3-ジヒドロ-1H-ベンズ〔d  
 e〕イソキノリン、1, 2, 3, 4, 4a, 5, 6, 7-  
 オクタヒドロナフト〔1, 8-bc〕アゼピン、2,  
 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-1H-ピリド  
 〔3, 2, 1-jk〕〔1〕ベンズアゼピン等の3環式  
 縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が  
 挙げられる。

【0034】上記式

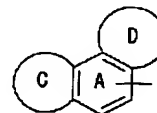
【化11】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基  
 の具体例としては、1, 2, 3, 5, 6, 7-ヘキサヒ  
 ドロベンズ〔1, 2-b:4, 5-b'〕ジピロール、  
 1, 2, 3, 5, 6, 7-ヘキサヒドロシクロペント  
 〔f〕インドール等の3環式縮合ベンゼン環から水素原  
 子を1個除去してできる基が挙げられる。

【0035】上記式

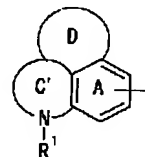
【化12】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基  
 の具体例としては、1, 2, 3, 6, 7, 8-ヘキサヒ  
 ドロシクロペント〔e〕インドール、2, 3, 4, 7,  
 8, 9-ヘキサヒドロ-1H-シクロペンタ〔f〕キノ  
 リン等の3環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去  
 してできる基が挙げられる。

【0036】このうち、式

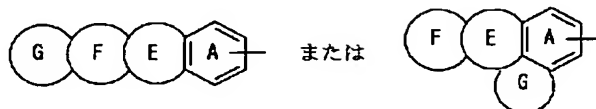
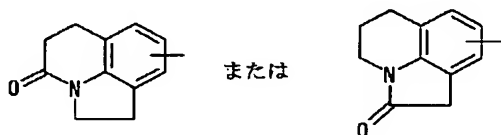
【化13】





等がさらに好ましい。

【0037】C'環または0037D'環で示される「オキソ基でさらに置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」は、B'環で示される「オキソ基でさらに置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」と同様のものが挙げられる。中でもより好ましくは、式【化15】



〔式中、A環は上記と同意義、E環、F環およびG環の少なくとも一つの環は置換基を有していてもよい複素環、その他の環は置換基を有していてもよい5ないし9員環を示す。〕で表される基等が挙げられる。E環、F環またはG環で示される「置換基を有していてもよい複素環」および「置換基を有していてもよい5ないし9員

で表される基等が挙げられる。

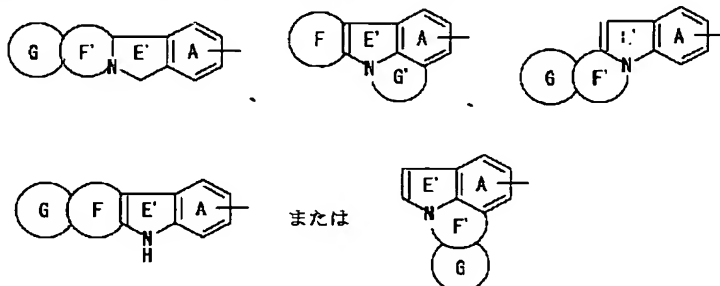
【0038】上記(3)の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」のフェニル基が置換基を有していてもよい3環式複素環と縮合する場合の具体例としては、例えば、式【化16】

環」は、B環またはC環で示される「置換基を有していてもよい複素環」および「置換基を有していてもよい5ないし9員環」がそれぞれ挙げられる。

【0039】このうち、好ましくは

(i) 式

【化17】



〔式中、A環は上記と同意義、E'環、F'環およびG'環は、それぞれオキソ基でさらに置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環、および--は単結合または二重結合を示す。〕で表される基、

【0040】(ii) 例えば、フルオランテン、アセフェナントリレン、アセアントリレン、トリフェニレン、ピレン、クリセン、ナфтаセン、プレイアデン、ベンゾ[a]アントラセン、インデノ[1,2-a]インデン、シクロペンタ[a]フェナントレン、ピリド[1',2':1,2]イミダゾ[4,5-b]キノキサリン、1H-2-オキサピレン、スピロ[ピペリジン-4,9'-キサンテン]等の環から水素原子を1個除去してできる基、およびこれらのジヒドロ体、テトラヒドロ体、ヘキサヒドロ体、オクタヒドロ体、デカヒドロ体等が挙げられる。E'環、F'環およびG'環で示される「オキソ基でさらに置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」は、B'環で示される「オキソ基でさらに置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」と同様のものが挙げられる。

【0041】上記式

【化18】

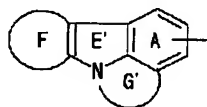


〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、2H-イソインドロ[2,1-e]プリン、1H-ピラゾロ[4',3':3,4]ピリド[2,1-a]イソインドール、1H-ピリド[2',3':4,5]イミダゾ[2,1-a]イソインドール、2H,6H-ピリド[1',2':3,4]イミダゾ[5,1-a]イソインドール、1H-イソインドロ[2,1-a]ベンズイミダゾール、1H-ピリド[3',4':4,5]ピロロ[2,1-a]イソインドール、2H-ピリド[4',3':4,5]ピロロ[2,1-a]イソインドール、1H-イソインドロ[2,1-a]インドール、2H-イソインドロ[1,2-a]イソインドール、1H-シクロペンタ[4,5]ピリミド[2,1-a]イソインドール、2H,4H-ピラノ

〔4', 3': 4, 5〕〔1, 3〕オキサジノ〔2, 3-a〕イソインドール, 2H-イソインドロ〔2, 1-a〕〔3, 1〕ベンズオキサジン, 7H-イソインドロ〔1, 2-b〕〔1, 3〕ベンズオキサジン, 2H-ピリド〔2', 1': 3, 4〕ピラジノ〔2, 1-a〕イソインドール, ピリド〔2', 3': 4, 5〕ピリミド〔2, 1-a〕イソインドール, ピリド〔3', 2': 5, 6〕ピリミド〔2, 1-a〕イソインドール, 1H-ピリド〔1', 2': 3, 4〕ピリミド〔2, 1-a〕イソインドール, イソインドロ〔2, 1-a〕キナゾリン, イソインドロ〔2, 1-a〕キノキサリン, イソインドロ〔1, 2-a〕イソキノリン, イソインドロ〔2, 1-b〕イソキノリン, イソインドロ〔2, 1-a〕キノリン, 6H-オキサジノ〔3', 4': 3, 4〕〔1, 4〕ジアゼピノ〔2, 1-a〕イソインドール, アゼピノ〔2', 1': 3, 4〕ピラジノ〔2, 1-a〕イソインドール, 2H, 6H-ピリド〔2', 1': 3, 4〕〔1, 4〕ジアゼピノ〔2, 1-a〕イソインドール, 1H-イソインドロ〔1, 2-b〕〔1, 3, 4〕ベンゾトリアゼピン, 2H-イソインドロ〔2, 1-a〕〔1, 3, 4〕ベンゾトリアゼピン, イソインドロ〔2, 1-d〕〔1, 4〕ベンズオキサゼピン, 1H-イソインドロ〔2, 1-b〕〔2, 4〕ベンゾジアゼピン, 1H-イソインドロ〔2, 1-c〕〔2, 3〕ベンゾジアゼピン, 2H-イソインドロ〔1, 2-a〕〔2, 4〕ベンゾジアゼピン, 2H-イソインドロ〔2, 1-d〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン, 5H-インドロ〔2, 1-b〕〔3〕ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ〔1, 2-a〕〔2〕ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ〔1, 2-b〕〔3〕ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ〔2, 1-b〕〔2〕ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ〔1, 2-b〕〔1, 3, 4〕ベンゾオキサジアゾシン, イソインドロ〔2, 1-b〕〔1, 2, 6〕ベンゾトリアゾシン, 5H-4, 8-メタノ-1H-〔1, 5〕ジアザシクロウンデシノ〔1, 11-a〕インドール等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

【0042】上記式

【化19】

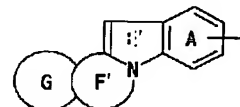


〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1H, 4H-ピロロ〔3', 2': 4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, ピロロ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 1H-フロ〔2', 3': 4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, 1H, 4H-シクロペンタ〔4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕キノキサリン, 1H, 4H-シクロペンタ〔4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロ

ロ〔1, 2, 3-de〕ベンズオキサジン, 〔1, 4〕オキサジノ〔2, 3, 4-jk〕カルバゾール, 1H, 3H-〔1, 3〕オキサジノ〔5, 4, 3-jk〕カルバゾール, ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕〔1, 4〕ベンゾチアジン, 4H-ピロロ〔3, 2, 1-de〕フェナンスリジン, 4H, 5H-ピリド〔3, 2, 1-de〕フェナンスリジン, 1H, 4H-3a, 6a-ジアザフルオロアンテン, 1-オキサー-4, 6a-ジアザフルオロアンテン, 4-オキサー-2, 10b-ジアザフルオロアンテン, 1-チア-4, 6a-ジアザフルオロアンテン, 1H-ピラジノ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 1H-インドロ〔3, 2, 1-de〕〔1, 5〕ナフチリジン, ベンゾ〔b〕ピラノ〔2, 3, 4-hi〕インドリジン, 1H, 3H-ベンゾ〔b〕ピラノ〔3, 4, 5-hi〕インドリジン, 1H, 4H-ピラノ〔2', 3': 4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, 1H, 3H-ベンゾ〔b〕チオピラノ〔3, 4, 5-hi〕インドリジン, 1H-ピリド〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 4H-3-オキサー-11b-アザシクロヘプタ〔jk〕フルオレン, 2H-アゼピノ〔1', 2': 1, 2〕ピリミジノ〔4, 5-b〕インドール, 1H, 4H-シクロヘプタ〔4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕キノキサリン, 5H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-ef〕〔1, 5〕ベンズオキサゼピン, 4H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-jk〕〔4, 1〕ベンゾチアゼピン, 5H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-ef〕〔1, 5〕ベンゾチアゼピン, 5H-ピリド〔4', 3': 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-ef〕〔1, 5〕ベンゾチアゼピン, 〔1, 2, 4〕トリアゼピノ〔6, 5, 4-jk〕カルバゾール, 〔1, 2, 4〕トリアゼピノ〔6, 7, 1-jk〕カルバゾール, 〔1, 2, 5〕トリアゼピノ〔3, 4, 5-jk〕カルバゾール, 5H-〔1, 4〕オキサゼピノ〔2, 3, 4-jk〕カルバゾール, 5H-〔1, 4〕チアゼピノ〔2, 3, 4-jk〕カルバゾール, 〔1, 4〕ジアゼピノ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 〔1, 4〕ジアゼピノ〔6, 7, 1-jk〕カルバゾール, アゼピノ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 1H-シクロオクタ〔4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕キノキサリン, 1H-シクロオクタ〔4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

【0043】上記式

【化20】

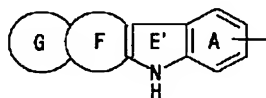


〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1H-インドロ〔1, 2-a〕ベンズイミダゾール, 1H-インドロ〔1, 2-b〕インダゾー

ル、ピロロ〔2', 1': 3, 4〕ピラジノ〔1, 2-a〕インドール, 1H, 5H-ピロロ〔1', 2': 4, 5〕ピラジノ〔1, 2-a〕インドール, 2H-ピリド〔2', 3': 3, 4〕ピロロ〔1, 2-a〕インドール, 1H-ピロロ〔2', 3': 3, 4〕ピリド〔1, 2-a〕インドール, 1H-インドロ〔1, 2-a〕インドール, 6H-イソインドロ〔2, 1-a〕インドール, 6H-インドロ〔1, 2-c〕〔1, 3〕ベンズオキサジン, 1H-インドロ〔1, 2-b〕〔1, 2〕ベンゾチアジン, ピリミド〔4', 5': 4, 5〕ピリミド〔1, 6-a〕インドール, ピラジノ〔2', 3': 3, 4〕ピリド〔1, 2-a〕インドール, 6H-ピリド〔1', 2': 3, 4〕ピリミド〔1, 6-a〕インドール, インドロ〔1, 2-b〕シンノリン, インドロ〔1, 2-a〕キナゾリン, インドロ〔1, 2-c〕キナゾリン, インドロ〔2, 1-b〕キナゾリン, インドロ〔1, 2-a〕キノキサリン, インドロ〔1, 2-a〕〔1, 8〕ナフチリジン, インドロ〔1, 2-b〕-2, 6-ナフチリジン, インドロ〔1, 2-b〕〔2, 7〕ナフチリジン, インドロ〔1, 2-b〕-1, 7-ナフチリジン, インドロ〔1, 2-b〕イソキノリン, インドロ〔2, 1-a〕イソキノリン, インドロ〔1, 2-a〕キノリン, 2H, 6H-ピリド〔2', 1': 3, 4〕〔1, 4〕ジアゼピノ〔1, 2-a〕インドール, 1H-インドロ〔2, 1-c〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン, 2H-インドロ〔1, 2-d〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン, 2H-インドロ〔2, 1-a〕〔2, 3〕ベンゾジアゼピン, 2H-インドロ〔2, 1-b〕〔1, 3〕ベンゾジアゼピン, 1H-インドロ〔1, 2-b〕〔2〕ベンズアゼピン, 2H-インドロ〔1, 2-a〕〔1〕ベンズアゼピン, 2H-インドロ〔2, 1-a〕〔2〕ベンズアゼピン, インドロ〔1, 2-e〕〔1, 5〕ベンゾジアゾシン, インドロ〔2, 1-b〕〔3〕ベンズアゾシン等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

【0044】上記式

・【化21】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1H-イミダゾ〔1', 2': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 1H-イミダゾ〔1', 2': 1, 6〕ピリド〔4, 3-b〕インドール, 1H-イミダゾ〔1', 5': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 1H-イミダゾ〔1', 5': 1, 6〕ピリド〔4, 3-b〕インドール, 1H-ピリド〔2', 1': 2, 3〕イミダゾ〔4, 5-b〕インドール, イミダゾ〔4, 5-a〕カルバゾール, イミダゾ〔4, 5-c〕カルバゾール, ピラゾロ〔3, 4-c〕カルバゾール, 2H

-ピラジノ〔1', 2': 1, 5〕ピロロ〔2, 3-b〕インドール, 1H-ピロロ〔1', 2': 1, 2〕ピリミド〔4, 5-b〕インドール, 1H-インドリジノ〔6, 7-b〕インドール, 1H-インドリジノ〔8, 7-b〕インドール, インドロ〔2, 3-b〕インドール, インドロ〔3, 2-b〕インドール, ピロロ〔2, 3-a〕カルバゾール, ピロロ〔2, 3-b〕カルバゾール, ピロロ〔2, 3-c〕カルバゾール, ピロロ〔3, 2-a〕カルバゾール, ピロロ〔3, 2-b〕カルバゾール, ピロロ〔3, 2-c〕カルバゾール, ピロロ〔3, 4-a〕カルバゾール, ピロロ〔3, 4-b〕カルバゾール, ピロロ〔3, 4-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕フロ〔3, 2-b〕インドール, 1H-フロ〔3, 4-a〕カルバゾール, 1H-フロ〔3, 4-b〕カルバゾール, 1H-フロ〔3, 4-c〕カルバゾール, 2H-フロ〔2, 3-a〕カルバゾール, 2H-フロ〔2, 3-c〕カルバゾール, 2H-フロ〔3, 2-a〕カルバゾール, 2H-フロ〔3, 2-b〕カルバゾール, 2H-フロ〔3, 2-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕チエノ〔2, 3-b〕インドール, チエノ〔3', 2': 5, 6〕チオピラノ〔4, 3-b〕インドール, チエノ〔3', 4': 5, 6〕チオピラノ〔4, 3-b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエノ〔2, 3-b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエノ〔3, 2-b〕インドール, 1H-チエノ〔3, 4-a〕カルバゾール, 2H-チエノ〔2, 3-b〕カルバゾール, 2H-チエノ〔3, 2-a〕カルバゾール, 2H-チエノ〔3, 2-b〕カルバゾール, シクロペンタ〔4, 5〕ピロロ〔2, 3-f〕キノキサリン, シクロペンタ〔5, 6〕ピリド〔2, 3-b〕インドール, ピリド〔2', 3': 3, 4〕シクロペンタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔2', 3': 4, 5〕シクロペンタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔3', 4': 3, 4〕シクロペンタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔3', 4': 4, 5〕シクロペンタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 4, 5〕シクロペンタ〔1, 2-b〕インドール, 1H-シクロペンタ〔5, 6〕ピラノ〔2, 3-b〕インドール, 1H-シクロペンタ〔5, 6〕チオピラノ〔4, 3-b〕インドール, シクロペンタ〔a〕カルバゾール, シクロペンタ〔c〕カルバゾール, インデノ〔1, 2-b〕インドール, インデノ〔2, 1-b〕インドール, 〔1, 2, 4〕トリアジノ〔4', 3': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 1, 3, 5-トリアジノ〔1', 2': 1, 1〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 1H-〔1, 4〕オキサジノ〔4', 3': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 1H-〔1, 4〕オキサジノ〔4', 3': 1, 6〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 4H-〔1, 3〕オキサジノ〔3', 4': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, インドロ〔3, 2-b〕〔1, 4〕ベンズオキサジン, 1, 3-オキサジノ〔6, 5-b〕カルバゾール, 2H-ピリミド〔2', 1': 2, 3〕〔1, 3〕チアジノ

〔5,6-b〕インドール, 2H-〔1,3〕チアジノ〔3', 2': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, 4H-〔1,3〕チアジノ〔3', 4': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, インドロ〔2,3-b〕〔1,4〕ベンゾチアジン, インドロ〔3,2-b〕〔1,4〕ベンゾチアジン, インドロ〔3,2-c〕〔2,1〕ベンゾチアジン, 1,4-チアジノ〔2,3-a〕カルバゾール, 〔1,4〕チアジノ〔2,3-b〕カルバゾール, 〔1,4〕チアジノ〔2,3-c〕カルバゾール, 1,4-チアジノ〔3,2-b〕カルバゾール, 1,4-チアジノ〔3,2-c〕カルバゾール, 1H-インドロ〔2,3-g〕アテリジン, 1H-インドロ〔3,2-g〕アテリジン, ピラジノ〔1', 2': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, ピラジノ〔1', 2': 1,2〕ピリド〔4,3-b〕インドール, 1H-ピリド〔2', 3': 5,6〕ピラジノ〔2,3-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 2': 5,6〕ピラジノ〔2,3-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 4': 5,6〕ピラジノ〔2,3-b〕インドール, ピリド〔1', 2': 1,2〕ピリミド〔4,5-b〕インドール, ピリド〔1', 2': 1,2〕ピリミド〔5,4-b〕インドール, ピリド〔2', 1': 2,3〕ピリミド〔4,5-b〕インドール, ピリミド〔1', 2': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, ピリミド〔1', 2': 1,6〕ピリド〔3,4-b〕インドール, ピリミド〔5', 4': 5,6〕ピラノ〔2,3-b〕インドール, ピラジノ〔4', 5': 5,6〕チオピラノ〔4,5-b〕インドール, 1H-インドロ〔3,2-c〕キノリン, 1H-インドロ〔2,3-b〕キノキサリン, 1H-ピラジノ〔2,3-a〕カルバゾール, 1H-ピラジノ〔2,3-b〕カルバゾール, 1H-ピラジノ〔2,3-c〕カルバゾール, 1H-ピラジノ〔3,4-c〕カルバゾール, 1H-ピラジノ〔4,5-b〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔4,5-a〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔4,5-c〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔5,4-a〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔5,4-b〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔5,4-c〕カルバゾール, 7H-1,4-ジオキシノ〔2', 3': 5,6〕〔1,2〕ジオキシノ〔3,4-b〕インドール, 6H-〔1,4〕ベンゾジオキシノ〔2,3-b〕インドール, 6H-〔1,4〕ベンゾジチイノ〔2,3-b〕インドール, 1H-インドロ〔2,3-b〕-1,5-ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-b〕〔1,6〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-b〕〔1,8〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-c〕-1,5-ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-c〕〔1,6〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-c〕〔1,7〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2,3-c〕〔1,8〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔3,2-b〕-1,5-ナフチリジン, 1H-インドロ〔3,2-b〕〔1,7〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔3,2-b〕〔1,8〕

ナフチリジン, 1H-インドロ〔3,2-c〕〔1,8〕ナフチリジン, インドロ〔2,3-a〕キノリジン, インドロ〔2,3-b〕キノリジン, インドロ〔3,2-a〕キノリジン, インドロ〔3,2-b〕キノリジン, ピラノ〔4', 3': 5,6〕ピリド〔3,4-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 4,5〕ピラノ〔3,2-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 5,6〕ピラノ〔2,3-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 5,6〕ピラノ〔3,4-b〕インドール, 1H-インドロ〔2,3-c〕イソキノリン, 1H-インドロ〔3,2-c〕イソキノリン, 1H-インドロ〔2,3-c〕キノリン, 1H-インドロ〔3,2-c〕キノリン, 1H-ピリド〔2,3-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔2,3-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔2,3-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,2-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,2-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,2-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,4-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,4-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3,4-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔4,3-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔4,3-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔4,3-c〕カルバゾール, 1H-キノンドリン, 1H-キノンドリン, 1H-ピラノ〔3', 4': 5,6〕ピラノ〔4,3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔2,3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔3,2-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔3,4-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔4,3-b〕インドール, 〔2〕ベンゾピラノ〔4,3-b〕インドール, ピラノ〔2,3-a〕カルバゾール, ピラノ〔2,3-b〕カルバゾール, ピラノ〔2,3-c〕カルバゾール, ピラノ〔3,2-a〕カルバゾール, ピラノ〔3,2-c〕カルバゾール, ピラノ〔3,4-a〕カルバゾール, 1H-ホスフィノリノ〔4,3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔2,3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔3,2-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔3,4-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔4,3-b〕インドール, 〔2〕ベンゾチオピラノ〔4,3-b〕インドール, 1H-ベンゾ〔a〕カルバゾール, 1H-ベンゾ〔b〕カルバゾール, 1H-ベンゾ〔c〕カルバゾール, 〔1,6,2〕オキサチアゼピノ〔2', 3': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, 1H-アゼピノ〔1', 2': 1,2〕ピリド〔3,4-b〕インドール, 1H-ピリド〔1', 2': 1,2〕アゼピノ〔4,5-b〕インドール, 2H-ピリド〔1', 2': 1,2〕アゼピノ〔3,4-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 2': 5,6〕オキセピノ〔3,2-b〕インドール, 1H-ピリド〔4', 3': 5,6〕オキセピノ〔3,2-b〕インドール, 2H-ピリド〔2', 3': 5,6〕オキセピノ〔2,3-b〕インドール, 2H-ピリド〔2', 3': 5,6〕オキセピノ〔3,2-b〕インドール, 2H-ピリド

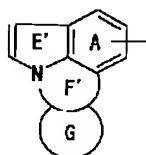
〔3', 4' : 5, 6〕オキセピノ〔3, 2-b〕インドール, ピリド〔2', 3' : 4, 5〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔3', 2' : 3, 4〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔3', 4' : 4, 5〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔3', 4' : 5, 6〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, 2H-ピラノ〔3', 2' : 2, 3〕アゼピノ〔4, 5-b〕インドール, 1H-インドロ〔3, 2-b〕〔1, 5〕ベンズオキサゼピン, 1H-インドロ〔3, 2-d〕〔1, 2〕ベンズオキサゼピン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 5〕ベンゾチアゼピン, 〔1, 4〕ジアゼピノ〔2, 3-a〕カルバゾール, インドロ〔2, 3-b〕〔1, 5〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔2, 3-d〕〔1, 3〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-b〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-b〕〔1, 5〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-d〕〔1, 3〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-d〕〔2, 3〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔2, 3-a〕〔3〕ベンズアゼピン, インドロ〔2, 3-c〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔2, 3-d〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔2, 3-d〕〔2〕ベンズアゼピン, インドロ〔3, 2-b〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔3, 2-c〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔3, 2-d〕〔1〕ベンズアゼピン, 1H-インドロ〔2, 1-b〕〔3〕ベンズアゼピン, 1H-〔1〕ベンズオキセピノ〔5, 4-b〕インドール, 1H-〔2〕ベンズオキセピノ〔4, 3-b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエピノ〔4, 5-b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエピノ〔5, 4-b〕インドール, ベンゾ〔3, 4〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ベンゾ〔4, 5〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ベンゾ〔5, 6〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, シクロヘプタ〔b〕カルバゾール, 4H-〔1, 5〕オキサゾシノ〔5', 4' : 1, 6〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, アゾシノ〔1', 2' : 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 2, 6-メタノ-2H-アゼシノ〔4, 3-b〕インドール, 3, 7-メタノ-3H-アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, ピリド〔1', 2' : 1, 8〕アゾシノ〔5, 4-b〕インドール, ピリド〔4', 3' : 6, 7〕オキサシノ〔2, 3-b〕インドール, ピリド〔4', 3' : 6, 7〕オキサシノ〔4, 3-b〕インドール, 1, 5-メタノ-1H-アゼシノ〔3, 4-b〕インドール, 2, 6-メタノ-1H-アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 4' : 5, 6〕シクロオクタ〔1, 2-b〕インドール, 1, 4-エタノオキサシノ〔3, 4-b〕インドール, ピラノ〔3', 4' : 5, 6〕シクロオクタ〔1, 2-b〕インドール, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 2, 5, 6〕ベンゾテトラゾシン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 6〕ベンゾジアゾシ

ン, 6, 13b-メタノ-13bH-アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, オキサシノ〔3, 2-a〕カルバゾール, 1H-ベンゾ〔g〕シクロオクタ〔b〕インドール, 6, 3-〔イミノメタノ〕-2H-1, 4-チアゾニノ〔9, 8-b〕インドール, 1H, 3H-〔1, 4〕オキサゾニノ〔4', 3' : 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 2H-3, 6-エタノアゾニノ〔5, 4-b〕インドール, 2H-3, 7-メタノアザシクロウンデシノ〔5, 4-b〕インドール, 1H-6, 12b-エタノアゾニノ〔5, 4-b〕インドール, インドロ〔3, 2-e〕〔2〕ベンズアゾニン, 5, 9-メタノアザシクロウンデシノ〔5, 4-b〕インドール, 3, 6-エタノ-3H-アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, 3, 7-メタノ-3H-アザシクロウンデシノ〔5, 4-b〕インドール, ピラノ〔4', 3' : 8, 9〕アゼシノ〔5, 4-b〕インドール, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 7〕ベンゾジアゼシン, 1H-インドロ〔3, 2-e〕〔2〕ベンズアゼシン, ベンゾ〔e〕ピロロ〔3, 2-b〕インドール, ベンゾ〔e〕ピロロ〔3, 2-g〕インドール, ベンゾ〔e〕ピロロ〔3, 2, 1-hi〕インドール, ベンゾ〔e〕ピロロ〔3, 4-b〕インドール, ベンゾ〔g〕ピロロ〔3, 4-b〕インドール, 1H-ベンゾ〔f〕ピロロ〔1, 2-a〕インドール, 1H-ベンゾ〔g〕ピロロ〔1, 2-a〕インドール, 2H-ベンゾ〔e〕ピロロ〔1, 2-a〕インドール, 1H-ベンゾ〔f〕ピロロ〔2, 1-a〕イソインドール, 1H-ベンゾ〔g〕ピロロ〔2, 1-a〕イソインドール, 2H-ベンゾ〔e〕ピロロ〔2, 1-a〕イソインドール, イソインドロ〔6, 7, 1-cde〕インドール, スピロ〔シクロヘキサ-1, 5'-〔5H〕ピロロ〔2, 1-a〕イソインドール〕, イソインドロ〔7, 1, 2-hij〕キノリン, 7, 11-メタノアゾシノ〔1, 2-a〕インドール, 7, 11-メタノアゾシノ〔2, 1-a〕イソインドール, ジベンズ〔cd, f〕インドール, ジベンズ〔cd, g〕インドール, ジベンズ〔d, f〕インドール, 1H-ジベンズ〔e, g〕インドール, 1H-ジベンズ〔e, g〕イソインドール, ナフト〔1, 2, 3-cd〕インドール, ナフト〔1, 8-e〕インドール, ナフト〔1, 8-fg〕インドール, ナフト〔3, 2, 1-cd〕インドール, 1H-ナフト〔1, 2-e〕インドール, 1H-ナフト〔1, 2-f〕インドール, 1H-ナフト〔1, 2-g〕インドール, 1H-ナフト〔2, 1-e〕インドール, 1H-ナフト〔2, 3-e〕インドール, 1H-ナフト〔1, 2-f〕イソインドール, 1H-ナフト〔2, 3-e〕イソインドール, スピロ〔1H-カルバゾール-1, 1'-シクロヘキサ〕, スピロ〔2H-カルバゾール-2, 1'-シクロヘキサ〕, スピロ〔3H-カルバゾール-3, 1'-シクロヘキサ〕, シクロヘプタ〔4, 5〕ピロロ〔3, 2-f〕キノリン, シクロヘプタ〔4, 5〕ピロロ〔3, 2-h〕キノリン, アゼピノ〔4, 5-b〕ベンズ〔e〕インドー

ル, 1H-アゼピノ〔1,2-a〕ベンズ〔f〕インドール, 1H-アゼピノ〔2,1-a〕ベンズ〔f〕イソインドール, ベンゾ〔e〕シクロヘプタ〔b〕インドール, ベンゾ〔g〕シクロヘプタ〔b〕インドール等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

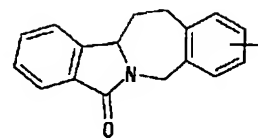
【0045】上記式

【化22】



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1H-ジピロロ〔2,3-b:3',2',1'-hi〕インドール, スピロ〔シクロペンタン-1,2' (1'H)-ピロロ〔3,2,1-hi〕インドール〕, スピロ〔イミダゾリジン-4,1' (2'H)-〔4H〕ピロロ〔3,2,1-ij〕キノリン〕, ピリド〔2,3-b〕ピロロ〔3,2,1-hi〕インドール, ピリド〔4,3-b〕ピロロ〔3,2,1-hi〕インドール, ベンゾ〔de〕ピロロ〔3,2,1-ij〕キノリン, 3H-ピロロ〔3,2,1-de〕アクリジン, 1H-ピロロ〔3,2,1-de〕フェナントリジン, スピロ〔シクロヘキサン-1,6'-〔6H〕ピロロ〔3,2,1-ij〕キノリン〕, 4,9-メタノピロロ〔3,2,1-lm〕〔1〕ベンゾアゾシン, スピロ〔シクロヘプタン-1,6'-〔6H〕ピロロ〔3,2,1-ij〕キノリン〕, 1H-ピラノ〔3,4-d〕ピロロ〔3,2,1-jk〕〔1〕ベンズアゼピン, 3H-ベンゾ〔b〕ピロロ〔3,2,1-jk〕〔4,1〕ベンズオキサゼピン, 7H-インドロ〔1,7-ab〕〔4,1〕ベンズオキサゼピン, ベンゾ〔b〕ピロロ〔3,2,1-jk〕〔1,4〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔1,7-ab〕〔1,4〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔1,7-ab〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔7,1-ab〕〔3〕ベンズアゼピン, 1H-シクロヘプタ〔d〕〔3,2,1-jk〕〔1〕ベンズアゼピン, スピロ〔アゼピノ〔3,2,1-hi〕インドール-7 (4H), 1'-シクロヘプタン〕, 4H-5,11-メタノピロロ〔3,2,1-no〕〔1〕ベンズアザシクロウンデシン, スピロ〔アゼピノ〔3,2,1-hi〕インドール-7 (4H), 1'-シクロオクタン〕等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。

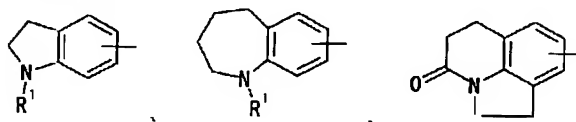
【0046】このうち、さらに好ましくは、式【化23】



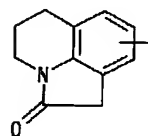
で表される基等である。

【0047】Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」として、好ましくは、例えば置換基を有していてもよい式

【化24】

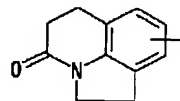


または



で表される基である。特に好ましくは、式

【化25】



で表される基である。

【0048】nは、好ましくは、1ないし6の整数である。さらに好ましくは2ないし6である。特に好ましくは2である。RおよびR'は、それぞれ水素原子、ハロゲン原子または置換基を有していてもよい炭化水素基を示し、nの繰り返しにおいて異なってもよい。RおよびR'で示される「ハロゲン原子」としては、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等が挙げられ、なかでもフッ素が好ましい。RおよびR'で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」としては、R<sup>1</sup>で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」と同様のものが挙げられる。RおよびR'としては水素原子またはフッ素が好ましい。RおよびR'としては水素原子がさらに好ましい。Yで示される「置換されていてもよいアミノ基」としては、例えば式

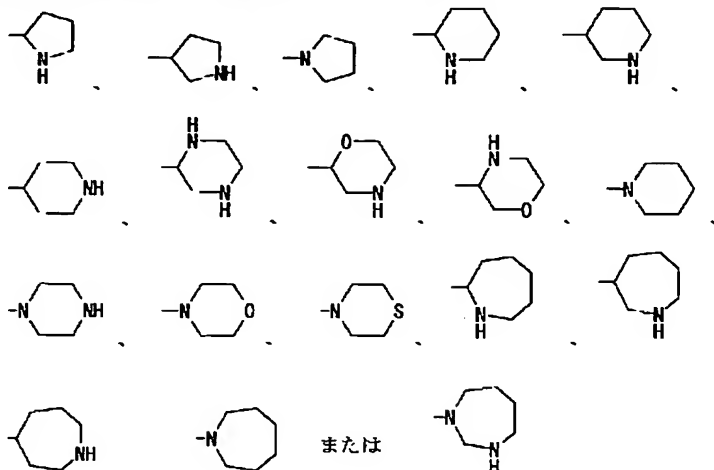
【化26】



〔式中、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、それぞれ水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基またはアシル基を示す。〕で表される基等が挙げられる。R<sup>4</sup>またはR<sup>5</sup>で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」および「アシル基」としては、R<sup>1</sup>で示される「置換基を有

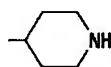
していてもよい炭化水素基」および「アシル基」と同様のものが挙げられる。

【0049】Yで示される「置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基」の「含窒素飽和複素環基」としては、炭素原子および1個の窒素原子以外に、窒素原子、



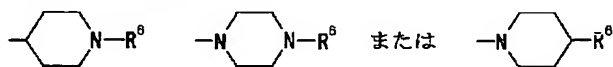
で表される基等が挙げられる。このうち、好ましくは6員環基である。さらに好ましくは

【化28】



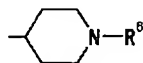
である。

【0050】該「置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基」の「置換基」としては、上記B環で示される



〔式中、 $R^6$  は $R^1$  と同意義を示す。〕で表される基等である。さらに好ましくは、式

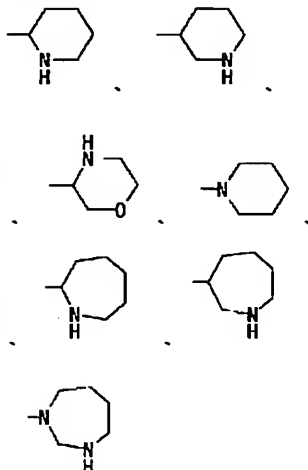
【化30】



〔式中、 $R^6$  は上記と同意義を示す。〕で表される基等である。 $R^6$  は、好ましくは、水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素基である。さらに好ましくは、ハロゲン原子（好ましくはフルオロ等）、 $C_{1-6}$

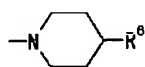
酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよい5ないし9員（好ましくは5ないし7員）含窒素飽和複素環基等が挙げられる。具体的には、式

【化27】



「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」と同様のものが挙げられ、その置換基数は1ないし5個である。また、該「置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基」の「含窒素飽和複素環基」の窒素は、上記 $R^1$ で表される基と同様のものを有していてもよい。Yとして、好ましくは式

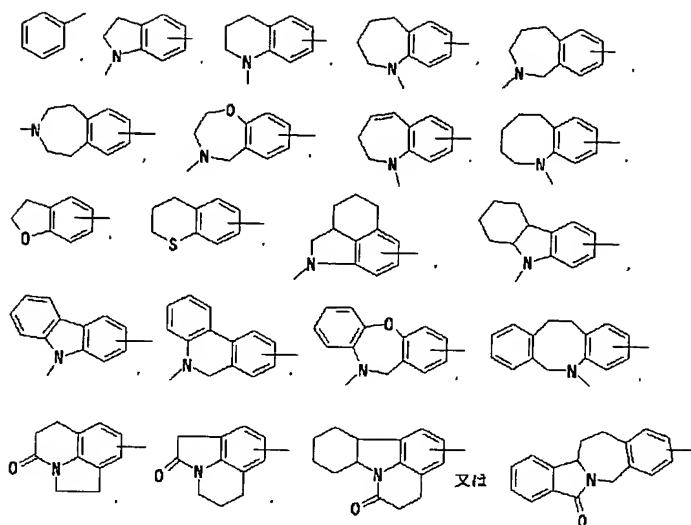
【化29】



アルキル（好ましくはメチル等）、 $C_{1-6}$  アルコキシ（好ましくはメトキシ等）、シアノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1ないし3個有していてもよい $C_{7-16}$  アラルキル基（好ましくはベンジル）等である。

【0051】化合物（I）として、好ましくは、Arが式

【化31】



で表される基で、このうちArがフェニル基の場合、該フェニル基は(i)ハロゲン(フルオロ等)、(ii)C<sub>1</sub>-6アルコキシ(メトキシ等)、(iii)アミノ、(iv)(モノまたはジ)C<sub>1</sub>-6アルキルアミノ(メチルアミノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等)、(v)ピロリジノ、(vi)ピペリジノ、(vii)ピペラジノ、(viii)N-メチルピペラジノ、(ix)N-アセチルピペラジノ、(x)モルホリノ、(xi)ヘキサメチレンイミノ、(xii)イミダゾリルおよび(xiii)C<sub>1</sub>-6アルキル(メチル等)でエステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよいC<sub>1</sub>-6アルキル(プロピル等)から選ばれる置換基を有していてもよく、

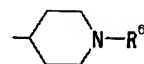
【0052】Arが縮合したフェニル基の場合、その複素環部分は①C<sub>1</sub>-6アルキル(メチル、エチル、プロピル、n-ブチル等)、②ハロゲン(フルオロ、クロロ等)、C<sub>1</sub>-6アルキル(メチル等)、C<sub>1</sub>-6アルコキシ(メトキシ等)およびニトロから選ばれる置換基を有していてもよいC<sub>7</sub>-16アラルキル(ベンジル、フェニルエチル等)、③C<sub>1</sub>-6アルキル-カルボニル(アセチル、プロピオニル、イソブチリル、ピバロイル等)、④C<sub>7</sub>-16アラルキル-カルボニル(フェニルアセチル等)、⑤C<sub>6</sub>-14アリール-カルボニル(ベンゾイル等)、⑥C<sub>1</sub>-6アルキル-カルボニル-C<sub>6</sub>-14アリール(メチルベンゾイル等)、⑦C<sub>1</sub>-6アルコキシ-カルボニル-C<sub>6</sub>-14アリール(メトキシベンゾイル等)および⑧ピリジルから選ばれる置換基を有していてもよく、nが2；RおよびR'がそれぞれ水素原子またはフッ素(より好ましくは水素原子)；すなわち、

【化32】



が-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CHFCH<sub>2</sub>-またはCF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-；Yが式

【化33】

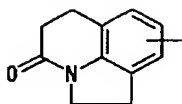


〔式中の記号は上記と同意義を示す。〕で表される基で、R<sup>6</sup>が①水素原子、②シアノ、ヒドロキシ、(モノまたはジ)C<sub>1</sub>-6アルキルアミノ(ジエチルアミノ等)、ピリジルおよび(C<sub>1</sub>-6アルキル(エチル等)で)エステル化されていてもよいカルボキシから選ばれる置換基を有していてもよいC<sub>1</sub>-6アルキル(メチル、エチル、イソプロピル等)、③ハロゲン(フルオロ、クロロ等)、C<sub>1</sub>-6アルキル(メチル、n-ブチル等)、ハロゲンC<sub>1</sub>-6アルキル(トリフルオロメチル等)、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>-6アルコキシ(メトキシ等)、ニトロ、アミノ、シアノ、カルバモイル、(C<sub>1</sub>-6アルキル等で)エステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよいC<sub>1</sub>-6アルコキシ(OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>CO<sub>2</sub>H、OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et等)、C<sub>1</sub>-6アルキルで置換されていてもよいカルバモイルまたはホルミルで置換されていてもよいアミノ(NHCHO、NHCONH<sub>2</sub>、NHCONHMe等)およびC<sub>1</sub>-3アルキレンジオキシ(メチレンジオキシ等)から選ばれる置換基を有していてもよいC<sub>7</sub>-16アラルキル(ベンジル、α-メチルベンジル、フェニルエチル等)、④(C<sub>1</sub>-6アルキル(エチル等)等で)エステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよいC<sub>1</sub>-6アルキル(メチル、プロピル等)または⑤(モノまたはジ)C<sub>1</sub>-6アルキルアミノ(ジメチルアミノ等)で置換されていてもよいC<sub>1</sub>-6アルキル-カルボニル(アセチル等)である化合物等が挙げられる。

【0053】化合物(I)として、さらに好ましくは、Arが式

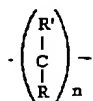
【化34】





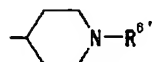
で表される基； $n$ が2； $R$ および $R'$ がそれぞれ水素原子またはフッ素（より好ましくは水素原子）；すなわち、

【化35】



が $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CHFCH}_2-$ または $\text{CF}_2\text{CH}_2-$ ； $Y$ が式

【化36】



〔式中、 $R^{6'}$ はハロゲン原子、 $C_1-3$ アルキル、 $C_1-3$ アルコキシ、シアノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1または2個有していてもよいベンジルを示す。〕で表される基である化合物等が挙げられる。

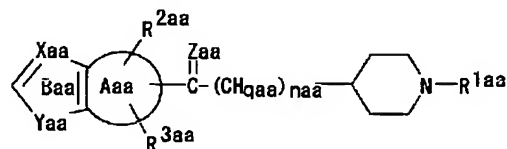
【0054】特に好ましくは、 $8-[3-[1-[(3\text{-フルオロフェニル})\text{メチル}]-4\text{-ピペリジニル}]-1-1\text{-オキソプロピル}]-1,2,5,6\text{-テトラヒドロ-4H-ピロロ}[3,2,1-i j]\text{キノリン-4-オン}$ 、 $8-[3-[1-(\text{フェニルメチル})-4\text{-ピペリジニル}]-1-1\text{-オキソプロピル}]-1,2,5,6\text{-テトラヒドロ-4H-ピロロ}[3,2,1-i j]\text{キノリン-4-オン}$ 、 $8-[3-[1-[(2\text{-ヒドロキシフェニル})\text{メチル}]-4\text{-ピペリジニル}]-1-1\text{-オキソプロピル}]-1,2,5,6\text{-テトラヒドロ-4H-ピロロ}[3,2,1-i j]\text{キノリン-4-オン}$ 、 $8-[2\text{-フルオロ-3-[1-[(3\text{-フルオロフェニル})\text{メチル}]-4\text{-ピペリジニル}]-1-1\text{-オキソプロピル}]-1,2,5,6\text{-テトラヒドロ-4H-ピロロ}[3,2,1-i j]\text{キノリン-4-オン}$ 、またはその塩等が挙げられるが、本発明の結晶が有効成分の安定性や有効性の面から最も好適である。

【0055】化合物(I)またはその塩は自体公知の方法またはそれに準じた方法によって製造することができる。具体的には、上記式中、(1)Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が縮合環を形成しない場合、特開平3-173867号(EP-A-0378207号)、特開昭64-79151号(EP-A-0296560号)記載の方法等、(2)Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が置換基を有していてもよい単環式複素環と縮合する場合、特開平5-140149号(E

P-A-0487071号)、特開平6-166676号(EP-A-0560235号)、特開平6-206875号(EP-A-0567090号)、特開平2-169569号(USP 4,895,841号)記載の方法等、(3)Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が置換基を有していてもよい2環式複素環と縮合する場合、あるいは2つの同一または異なった単環(但し、少なくとも一方の環が単環式複素環である)と縮合する場合、特開平7-206854号(EP-A-0607864号)記載の方法等、および(4)Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が置換基を有していてもよい3環式複素環と縮合する場合、特開平7-309835(EP-A-0655451号)記載の方法等に準じて目的物を製造すればよい。

【0056】2)式

【化37】

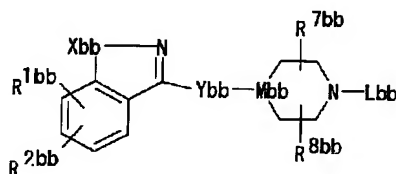


〔式中、 $C=Zaa$ を含む側鎖、 $R^{2aa}$ あるいは $R^{3aa}$ のうちひとつは、環Baaの\*で示した炭素原子に結合し、環Aaaはベンゾ、チエノ、ピリド、ピラジノ、ピリミド、フラノ、セレノ、ピロロ、チアゾロあるいはイミダゾロを示し、 $R^{1aa}$ はフェニル、フェニル- $C_1-6$ アルキル、シンナミルまたはヘテロアリールメチル(ここでヘテロアリール基としては、イミダゾロ、チアゾロ、チエノ、ピリドまたはイソオキサゾロを示す)を示し、フェニルおよびヘテロアリール基は $C_1-6$ アルキル、 $C_1-6$ アルコキシおよびハロゲンから選ばれる置換基を1~2個有していてもよい。 $R^{2aa}$ および $R^{3aa}$ は、それぞれ独立して、水素原子、 $C_1-6$ アルコキシ、1~3個のフッ素で置換されていてもよい $C_1-6$ アルキル基、ベンジルオキシ、ヒドロキシ、フェニル、ベンジル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $\text{COOR}^{4aa}$ 、 $\text{CONHR}^{4aa}$ 、 $\text{NR}^{4aa}\text{R}^{5aa}$ 、 $\text{NR}^{4aa}\text{COR}^{5aa}$ または $\text{SO}paa\text{CH}_2\text{Ph}$ (ここで $paa$ は0, 1または2を示す)を示すか、 $R^{2aa}$ と $R^{3aa}$ は隣接する炭素原子と共に5ないし6員環(環の構成原子は、炭素、窒素、酸素)、例えばメチレンジオキシ、エチレンジオキシあるいはラクタム環を形成してもよい。また、 $R^{4aa}$ および $R^{5aa}$ はそれぞれ独立して、水素原子または $C_1-6$ アルキル基を示すか、 $\text{NR}^{4aa}\text{R}^{5aa}$ の $R^{4aa}$ および $R^{5aa}$ は隣接する窒素原子と共に窒素原子を少なくとも1個含む4ないし8員環(環の他の構成原子は炭素、酸素または窒素である。)を形成してもよい。また $\text{NR}^{4aa}\text{COR}^{5aa}$ の $R^{4aa}$ および $R^{5aa}$ は隣接する窒素原子および炭素原子と共に4ないし8員ラクタム

環を形成してもよい。Xaaは窒素あるいはCHを、Yaaは酸素、イオウあるいはNR<sup>6aa</sup>を示す。R<sup>6aa</sup>は水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル、CO-C<sub>1-6</sub>アルキルあるいはSO<sub>2</sub>-フェニル（ここで、フェニル基はC<sub>1-4</sub>アルキルから独立して選ばれる1ないし5個の置換基を有していてもよい）を示す。naaは1ないし4の整数を、それぞれのqaaは独立して1ないし2を、Zaaは酸素あるいはイオウを示す。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-(2-メチル-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-プロパノン、1-(6-メチルベンゾ[b]チエ-2-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-プロパノン、1-(6-メチルインドール-2-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-プロパノン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、WO 93/07140記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0057】3) 式

【化38】

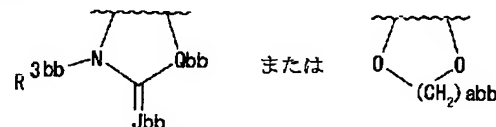


〔式中、R<sup>1bb</sup> および R<sup>2bb</sup> はそれぞれ、水素原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、ベンジルオキシ、フェノキシ、ヒドロキシ、フェニル、ベンジル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、式: COR<sup>5bb</sup>、-COOR<sup>5bb</sup>、-CONHR<sup>5bb</sup>、-NR<sup>5bb</sup> R<sup>6bb</sup> または NR<sup>5bb</sup> COR<sup>6bb</sup> (式中、R<sup>5bb</sup> および R<sup>6bb</sup> はそれぞれ i) 水素原子、ii) C<sub>1-6</sub>アルキル、iii) ハロゲン、C<sub>1-4</sub>アルキル、トリフルオロメチル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、シアノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1または2個それぞれ有していてもよいフェニルまたはベンジル; または NR<sup>5bb</sup> R<sup>6bb</sup> の R<sup>5bb</sup> と R<sup>6bb</sup> とは一緒になって4ないし8員含窒素環を形成、NR<sup>5bb</sup> COR<sup>6bb</sup> の R<sup>5bb</sup> と R<sup>6bb</sup> とは一緒になって4ないし8員ラクタム環を形成する) で表される基、1ないし3個のフッ素で置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル、式: SO<sub>pbb</sub> CH<sub>2</sub>-フェニル または SO<sub>pbb</sub> C<sub>1-6</sub>アルキル (式中、pbbは0、1または2を示す) で表される基、ピリジリメチルオキシ、チエニルメチルオキシ、2-オキサゾリル、2-チアゾリルまたはベンゼンスルホンアミド (該フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニル、ベンジル、ベンゼンスルホンアミド、ピリジリメチルオキシ、チエニルメチルオキシ、2-オキサゾリル、2-チアゾリルは、ハロゲン、C<sub>1-6</sub>アルキル、

トリフルオロメチル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、シアノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1または2個を有していてもよい); または R<sup>1bb</sup> および R<sup>2bb</sup> は隣接する炭素原子に結合する場合および Xbbが酸素、硫黄または NR<sup>4bb</sup> (R<sup>4bb</sup>は、水素またはC<sub>1-4</sub>アルキルである) である場合、これらが結合する炭素原子と一緒に式

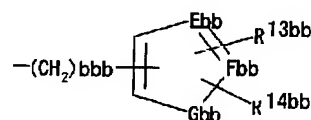
【0058】

【化39】



〔式中、Jbbは酸素、硫黄または NR<sup>4bb</sup>、abbは1または2、R<sup>3bb</sup>は水素またはC<sub>1-6</sub>アルキル Qbbは酸素、硫黄、NH、CHCH<sub>3</sub>、C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH=CH- または (CH<sub>2</sub>)<sub>1bb</sub>、および 1bbは1ないし3の整数を示す。〕で表される基を形成; Xbbは酸素、硫黄、-CH=CH-、-CH=N-、-NH=CH-、-N=N- または NR<sup>4bb</sup> (R<sup>4bb</sup>は上記と同意義); Ybbは -(CH<sub>2</sub>)<sub>nbb</sub>、-CH=CH(CH<sub>2</sub>)<sub>nbb</sub>、-NR<sup>4bb</sup> (CH<sub>2</sub>)<sub>nbb</sub> または -O(CH<sub>2</sub>)<sub>nbb</sub> (R<sup>4bb</sup>は上記と同意義、nbbは0ないし3の整数、mbbは1ないし3の整数; Mbbは -CH- または窒素; Lbbは i) ハロゲン、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニルまたはC<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルから選ばれる置換基を1ないし3個それぞれ有していてもよいフェニルまたはフェニル-C<sub>1-6</sub>アルキル、ii) シンナミル、iii) ピリジリメチル、または iv) 式:

【化40】



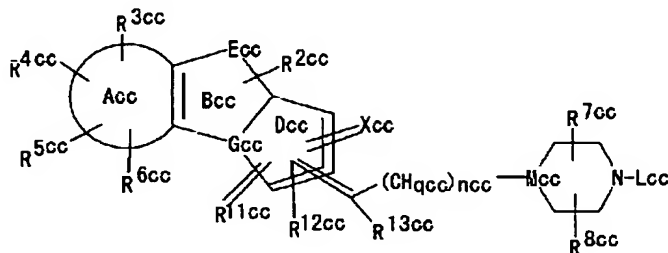
〔式中、bbbは1ないし4の整数、R<sup>13bb</sup> および R<sup>14bb</sup> はそれぞれ水素、C<sub>1-4</sub>アルキル、ハロゲンまたはフェニル、EbbおよびFbbはそれぞれ -CH- または窒素、Gbbは酸素、硫黄または NR<sup>4bb</sup> (R<sup>4bb</sup>は上記と同意義) を示す。但し、EbbおよびFbbが両者とも窒素の場合、R<sup>13bb</sup> および R<sup>14bb</sup> の一方は存在せず。〕で表される基; R<sup>7bb</sup> および R<sup>8bb</sup> はそれぞれ水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ-カルボニル、C<sub>1-6</sub>アルキル-カルボニルまたはC<sub>1-6</sub>アルコキシを示す。但し、該C<sub>1-6</sub>アルコキシは窒素に隣接する炭素原子には結合しない。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、3-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]

エチル]-5, 6, 8-トリヒドロ-7H-イソキサゾロ[4, 5-g]キノリン-7-オン、6, 8-ジヒドロ-3-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]エチル]-7H-ピロロ[5, 4-g]-1, 2-ベンズイソキサゾール-7-オン、5, 7-ジヒドロ-3-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリル]エチル]-6H-ピロロ[5, 4-f]-1, 2-

ベンズイソキサゾール-6-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平6-500794号公報(WO 92/17475)記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0059】4) 式

【化41】



〔式中、環Accはベンゾ、チエノ、ピリド、ピラジノ、ピリミド、フラノ、セレンオロまたはピロロ； $R^{2cc}$ は水素、 $C_1-4$ アルキル、ベンジル、フルオロまたはシアノ； $R^{3cc}$ 、 $R^{4cc}$ 、 $R^{5cc}$ および $R^{6cc}$ はそれぞれ、水素、 $C_1-6$ アルコキシ、ベンジロキシ、フェノキシ、ヒドロキシ、フェニル、ベンジル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $-COOR^{9cc}$ 、 $-CONHR^{9cc}$ 、 $-NR^{9cc}R^{10cc}$ 、 $-NR^{9cc}COR^{10cc}$ 、または1ないし3個のフッ素原子で置換されていてもよい $C_1-6$ アルキル； $SO_pccCH_2$ -フェニル( $pcc$ は0、1または2)、ビリジルメチルオキシまたはチエニルメチルオキシ(該フェノキシ、ベンジロキシ、フェニル、ビリジルメチルオキシおよびチエニルメチルオキシは、ハロゲン、 $C_1-4$ アルキル、トリフルオロメチル、 $C_1-4$ アルコキシ、シアノ、ニトロおよびヒドロキシから選ばれる置換基を1または2個有していてもよい)；または $R^{3cc}$ 、 $R^{4cc}$ 、 $R^{5cc}$ および $R^{6cc}$ の2つは、隣接する炭素原子と一緒に、該隣接炭素原子と共に環の各原子が炭素、窒素または酸素である飽和5または6員環(例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシまたはラクタム環)を形成； $R^{9cc}$ および $R^{10cc}$ はそれぞれ水素または $C_1-6$ アルキル、または $NR^{9cc}R^{10cc}$ の $R^{9cc}$ および $R^{10cc}$ は一緒になって環の1つの原子が窒素であり、他が炭素である4ないし8員環状アミノ基を形成、または $NR^{9cc}COR^{10cc}$ の $R^{9cc}$ および $R^{10cc}$ は、一緒になって4ないし8員環状ラクタム環を形成；

【0060】 $Gcc$ は炭素または窒素； $Ecc$ は炭素、窒素、酸素、硫黄、スルホキシドまたはスルホン；

【化42】

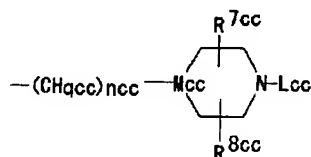
は単結合または二重結合；環Dccの1-、2-または3-位のいずれかにある炭素がカルボニル基に隣接している場合、適宜窒素で置換されていてもよい(該炭素は環

Dccの1-、2-または3-位にあるため環はラクタム環となる)； $Xcc$ はO、S、 $NOR^{1cc}$ 、水素または $C_1-6$ アルキル(但し、 $Xcc$ が結合している環Dccの原子が炭素であり、 $Xcc$ がO、S、 $NOR^{1cc}$ であるときのみ、 $Xcc$ は環Dccに二重結合する)； $R^{1cc}$ は水素または $C_1-6$ アルキル； $qcc$ は1または2；環Dccがラクタム環の場合、 $ncc$ は1ないし3の整数、環Dccがラクタム環ではない場合、 $ncc$ は0または1ないし3の整数； $Mcc$ は炭素または窒素； $Lcc$ はフェニル、フェニル- $C_1-6$ アルキル、シンナミルまたはビリジルメチル(該フェニルおよびフェニル- $C_1-6$ アルキルは、 $C_1-6$ アルキル、 $C_1-6$ アルコキシ、 $C_1-6$ アルコキシ-カルボニル、 $C_1-6$ アルキル-カルボニルおよびハロゲンから選ばれる置換基を1ないし3個有していてもよい)； $R^{11cc}$ は水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1-4$ アルキル、 $C_1-4$ アルコキシまたは酸素； $R^{12cc}$ および $R^{13cc}$ はそれぞれ、水素、フルオロ、ヒドロキシ、アセトキシ、 $o$ -メシレート、 $o$ -トシレート、 $C_1-4$ アルキルまたは $C_1-4$ アルコキシ；または $R^{12cc}$ および $R^{13cc}$ の両者が炭素原子に結合している場合、それらが結合している原子と一緒に、環の各原子が炭素または酸素である3ないし5員環を形成； $R^{7cc}$ および $R^{8cc}$ はそれぞれ、水素、 $C_1-6$ アルキルまたは $C_1-6$ アルコキシ(該 $C_1-6$ アルコキシは、窒素、 $C_1-6$ アルコキシ-カルボニルおよび $C_1-6$ アルキル-カルボニルに隣接している炭素とは結合しない)；または $R^{8cc}$ および $R^{12cc}$ はそれらが結合している原子と一緒に、4ないし7員飽和炭素環を形成する(上記炭素原子の1つは、酸素、窒素または硫黄で置換されていてもよい)。

【0061】但し、(a)  $Ecc$ が炭素、窒素、酸素、硫黄、スルホキシドまたはスルホンの場合、 $Gcc$ は炭素であり；(b)  $Gcc$ が窒素の場合、 $Ecc$ は炭素または窒素であり；(c)  $Ecc$ と $Gcc$ の両者が窒素の場合、 $Gcc$

が炭素であり、Eccが酸素、硫黄、スルホキシドまたはスルホンの場合、 $R^{2cc}$ はなく；(d) 環Dccの1-、2-および3-位の原子の各々は1つをこえた二重結合で結合することはない；(e)  $R^{11cc}$ が酸素の場合、環Dccに二重結合し、 $R^{11cc}$ が酸素以外の場合、環Dccに一重結合し；(f) Xccと $R^{11cc}$ の両者が酸素で、かつ各々環Dccの1-および3-位の炭素に結合している、または各々環Dccの3-および1-位の炭素に結合している場合、環Dccの2-位の炭素は窒素で置換されており；(g)

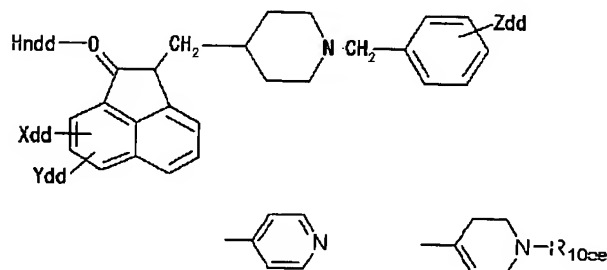
【化43】



を含有する炭化水素基が結合している位置に隣接する位置でXccが環Dccに結合する。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、2, 3-ジヒドロ-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチレン]-1H-ピロロ[1, 2-a]インドール-1-オン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-4-メチル-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチレン]-シクロペンタ[b]インドール-3-オン、2, 3-ジヒドロ-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチル]-1H-ピロロ[1, 2-a]ベンズイミダゾール-1-オン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-メチル-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]エチル]-ピロロ[3, 4-b]インドール-3-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-234845号公報(E P-A-441517)記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0062】5) 式

【化44】

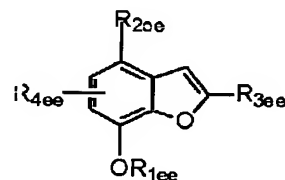


(ここで、 $R_{10ee}$ は水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、 $\text{CONHR}_{5ee}$ 、 $\text{CONR}_{6ee}$ 、 $R_{7ee}$ 、アシル、アシルオキシ低級アルキルまたはアシルオキシアリール低級アルキルである)； $R_{4ee}$ は水素、ハロゲン、低級アルキルまたは低級アルコキシ；

〔式中、Xddは水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシまたはニトロ；Yddは水素または低級アルコキシ；またはXddとYddはいっしょに結合して基- $\text{OC H}_2\text{O}$ -を形成(この場合にはベンゼン環部分のXddとYddの各位置は互いに隣接していなければならない)；Zddは水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ、ハロゲンまたはニトロ；nddは0または1である。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては2-[(N-ベンジルピペリジン-4-イル)メチル]-2a, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1(2H)-アセナフチレン-1-オン、2-[[N-(3-フルオロベンジル)ピペリジン-4-イル]メチル]-2a, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1(2H)-アセナフチレン-1-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平6-116237号公報(E P-A-517221, USP 5, 106, 856)記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0063】6) 式

【化45】



〔式中、 $R_{1ee}$ は水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、 $\text{CONHR}_{11ee}$ または $\text{CONR}_{6ee}$ 、 $R_{7ee}$ ； $R_{2ee}$ は水素、シアノ、 $\text{CH}_2\text{NR}_{8ee}$ 、 $R_{9ee}$ 、 $\text{CONHR}_{5ee}$ または $\text{CONR}_{6ee}$ 、 $R_{7ee}$ ； $R_{3ee}$ は

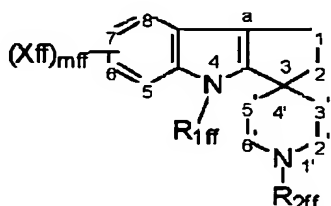
【化46】

$R_{5ee}$ は水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキル； $R_{6ee}$ は低級アルキルまたはアリール低級アルキル； $R_{7ee}$ は低級アルキルまたはアリール低級アルキル； $R_{8ee}$ は水素、低級アルキル、アリール低級アルキルまたはアシル； $R_{9ee}$ は水素、低級アルキルま

たはアリール低級アルキル； $R_{1ee}$ は低級アルキル、アリールまたはアリール低級アルキルである。但し、 $R_{1ee}$ が水素または低級アルキルである場合、 $R_{2ee}$ は水素ではない。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-メチル-4-(4-シアノ-7-メトキシ-2-ベンゾフラニル)ピペリジン、1-メチル-4-(4-N,N-ジエチルアミド-7-メトキシ-2-ベンゾフラニル)ピペリジン、1-メチル-4-(4-N,N-ジエチルアミノメチル-7-メトキシ-2-ベンゾフラニル)ピペリジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平7-109275号公報記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

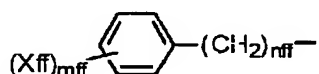
【0064】7)式

【化47】



〔式中、Xffは水素、ハロゲン、低級アルコキシ、低級アルキル、ヒドロキシまたはトリフルオロメチル；mffは1または2； $R_{1ff}$ は水素または低級アルキル； $R_{2ff}$ は水素、式

【化48】



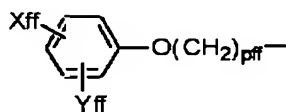
〔式中、nffは1または2、Xffおよびmffは上記と同意義を示す〕で表される基、式

【化49】



〔式中、Xffとmffは上記と同意義を示す〕で表される基、または式

【化50】

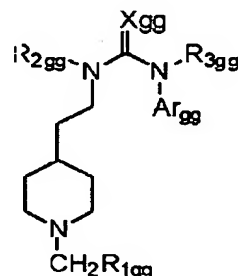


〔式中、Xffは上記と同意義、Yffは水素または式： $OR_{4ff}$ （式中、 $R_{4ff}$ は水素または低級アルキルを示す）、pffは2または3を示す〕である。〕で表される化合物またはその塩。具体的には、1,4-ジヒドロ-7-メトキシ-4-メチル-1'-フェニルメチルスピロ〔シクロペンタ〔b〕インドール-3(2H), 4'-ピペリジン〕、1,4-ジヒドロ-4-メチル-1'-(4-メトキシフェニル)メチルスピロ〔シクロ

ペンタ〔b〕インドール-3(2H), 4'-ピペリジン〕等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、WO 97/37992記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0065】8)式

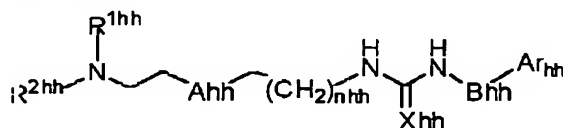
【化51】



〔式中、 $R_{1gg}$ は $C_5-7$ シクロアルキル基、フェニル基、または $C_1-4$ アルキル基、 $C_1-4$ アルコキシ基、ニトロ基若しくはハロゲン原子で置換されたフェニル基； $R_{2gg}$ および $R_{3gg}$ は、互いに独立して水素原子または $C_1-4$ アルキル基；Xggはイオウ原子、酸素原子、 $CH-NO_2$ 基または $N-R_{5gg}$ 基（ここで $R_{5gg}$ は水素原子、ヒドロキシル基、 $C_1-4$ アルコキシ基、 $C_1-4$ アルキル基、シアノ基または $C_1-4$ アルキルスルホニル基；Arggは、ハロゲン原子、 $C_1-4$ アルキル基、 $C_1-4$ アルコキシ基、 $C_1-4$ アシル基、シアノ基、ニトロ基、トリフルオロメチル基およびトリフルオロメトキシ基から選ばれる置換基を1若しくは2以上それぞれ有していてもよいピリジル基またはフェニル基を意味する。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、N-フェニル-N'-〔2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル〕-1,1-ジアミノ-2-ニトロエチレン、1-(2-ピペリジル)-3-〔2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル〕チオ尿素、1-フェニル-2-ヒドロキシ-3-〔2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル〕グアニジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-148228号公報（EP-A-516520）に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

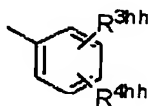
【0066】9)式

【化52】



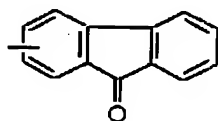
〔式中、 $R_{1hh}$ は $C_1-4$ アルキル基、 $R_{2hh}$ は $C_5-7$ シクロアルキル基、 $C_5-7$ シクロアルキルメチル基、ベンジル基、または $C_1-4$ アルキル基、 $C_1-4$ アルコキシ基、ハロゲン原子若しくはニトロ基

を有するベンジル基; Ahhは酸素原子またはメチレン基; Bhhは直接結合、メチレン基またはカルボニル基; Arhhはピリジル基、下式のフェニル基、  
【化53】

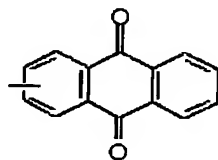


(ここで、R3hhとR4hhは互いに独立して、水素、ハロゲン原子、ニトロ基、C<sub>1</sub>-4アルキル基、C<sub>1</sub>-4アルコキシ基、フェニル基またはトリフルオロメトキシ基を意味する)、下式のおキソフルオレニル基、

【化54】



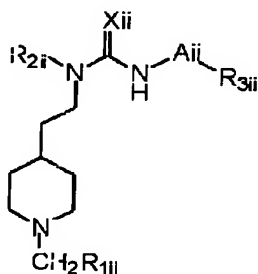
下式のジオキサントラセニル基、  
【化55】



またはナフチル基を、nhhは1または2を、Xhhは酸素原子またはイオウ原子を意味する。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-[2-[2-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)エトキシ]エチル]-3-(3-ニトロベンゾイル)チオ尿素、1-[2-[2-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)エトキシ]エチル]-3-(9-オキソ-2-フルオレノイル)チオ尿素等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-194359号公報(EP-A-526313)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

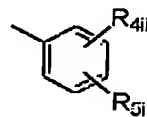
【0067】10)式

【化56】



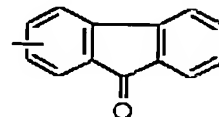
(式中、R111はC<sub>5</sub>-7シクロアルキル基、フェニル基、またはC<sub>1</sub>-4アルキル基、C<sub>1</sub>-4アルコキシ

ル基若しくはハロゲン原子で置換されたフェニル基; R211は水素原子またはC<sub>1</sub>-4アルキル基; Xiiは酸素原子またはイオウ原子; Aiiはメチレン基、カルボニル基またはスルホニル基; R311は③式  
【化57】



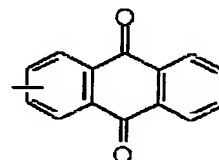
(ここで、R411とR511は互いに独立して、水素、ハロゲン原子、ニトロ基、C<sub>1</sub>-4アルキル基、C<sub>1</sub>-4アルコキシ基、C<sub>1</sub>-4アシル基、ベンゾイル基、C<sub>1</sub>-4アルキルスルホニル基またはトリフルオロメトキシ基を表すか、またはR411とR511が一緒になってメチレンジオキシ基を形成)で表される基、  
③式

【化58】



で表される基または④式

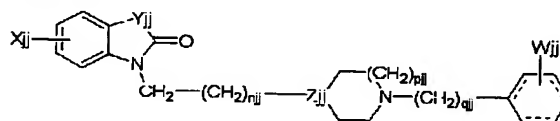
【化59】



で表される基; 但し、Xiiが酸素原子を表すときは、Aiiはメチレン基以外の基を表す。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-(3-ニトロベンゾイル)-3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]チオ尿素、1-(9,10-ジオキソ-2-アントラセノイル)-3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]チオ尿素等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平6-507387号公報(WO 92/14710)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0068】11)式

【化60】



(式中、njjは1、2または3であり; pjjは1または2であり; qjjは1または2であり; Xjjは独立して水素、低級アルキル、アリール、アリールオキシ、CN、低級アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、アルキルスルホンアミド、NHCOR

jj (ここで、R<sub>jj</sub>は低級アルキルまたはアリールである)、NR<sub>1jj</sub>R<sub>2jj</sub> (ここで、R<sub>1jj</sub> および R<sub>2jj</sub> は独立して水素または低級アルキルであるか、一緒になって環を形成する)、CO<sub>2</sub>R<sub>jj</sub> (ここで、R<sub>jj</sub> は低級アルキルである)、または場合によっては、さらに低級アルキルにより置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル若しくはビスシクロアルキルから選択される1個以上の置換基であり；Y<sub>jj</sub>はCOまたはCR<sub>3jj</sub>R<sub>4jj</sub> (ここで、R<sub>3jj</sub> および R<sub>4jj</sub> は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシであるか、または一緒になって環状アセタールを形成する)であり；Z<sub>jj</sub>はNまたはCHであり；

【化61】



は場合によっては置換されたフェニルまたはシクロヘキシル基である (ここで、W<sub>jj</sub>は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシまたはハロゲンから選択される1個以上の置換基である) で表される化合物 (但し、n<sub>jj</sub>=1、p<sub>jj</sub>=1、q<sub>jj</sub>=1、X<sub>jj</sub>=H、Y<sub>jj</sub>=CO、Z<sub>jj</sub>=Nかつ

【化62】



が未置換フェニルである化合物、および n<sub>jj</sub>=2、p<sub>jj</sub>=1、q<sub>jj</sub>=1、X<sub>jj</sub>=H、Y<sub>jj</sub>=CO、Z<sub>jj</sub>=Nかつ

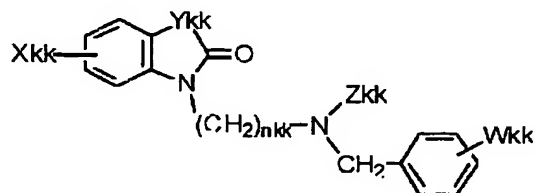
【化63】



が4-クロロフェニルである化合物を除く)、その立体異性体、光学異性体、ラセミ体またはそれらの塩。具体例としては、5-シクロヘキシル-1, 3-ジヒドロ-1-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]エチル]-2H-インドール-2-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平7-502272号公報 (WO 93/12085) に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0069】12) 式

【化64】

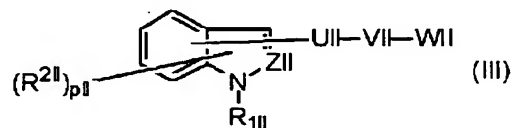


【式中、n<sub>kk</sub>は3、4、5、6または7；X<sub>kk</sub>は独立して水素、低級アルキル、アリール、低級アルコキシ、ハ

ロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、-NHCO<sub>Rkk</sub> (ここで、R<sub>kk</sub>は低級アルキルまたはアリールである)、-NR<sub>1kk</sub>R<sub>2kk</sub> (ここで、R<sub>1kk</sub> および R<sub>2kk</sub> は独立して水素または低級アルキルであるか、または一緒になって環を形成する)、または場合によっては、さらに低級アルキルにより置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル若しくはビスシクロアルキルから選択される1個以上の置換基；Y<sub>kk</sub>はCOまたはCR<sub>3kk</sub>R<sub>4kk</sub> (ここで、R<sub>3kk</sub> および R<sub>4kk</sub> は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシであるか、または一緒になって環状アセタールを形成する)；Z<sub>kk</sub>は低級アルキル；そして、W<sub>kk</sub>は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシまたはハロゲンから選択される1個以上の置換基である。) で表される化合物、その立体異性体、光学異性体、ラセミ体またはそれらの塩。具体例として、5-シクロヘキシル-1, 3-ジヒドロ-1-[5-(N-エチル-N-フェニルメチルアミノ)ペンチル]-2H-インドール-2-オン、5-シクロヘキシル-1-[5-(N-エチル-N-フェニルメチルアミノ)ペンチル]-1H-インドール-2, 3-ジオン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平8-511515号公報 (WO 94/29272) に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0070】13) 式

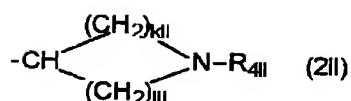
【化65】



【式中、R<sub>111</sub> および R<sub>211</sub> は、それぞれ水素原子、下記置換基群A11より選択された基、または下記置換基群A11より選択された1ないし3個の置換基 (同一または異なって) をそれぞれ有していてもよいアリール基、アラルキル基、アラルキルオキシカルボニル基、アリールアミノ基、アリールアミノアルキル基、複素環基、複素環アルキル基若しくは複素環アミノアルキル基；p<sub>11</sub>は1ないし3の整数を示す。；U<sub>11</sub>は式：-CO- または -CH(OR<sub>311</sub>)- で表される基 (式中、R<sub>311</sub> は水素原子または水酸基の保護基を示す)；V<sub>11</sub>は式：-(CH=CH)<sub>m11</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>n11</sub> で表される基 (式中、m<sub>11</sub>は0ないし2、n<sub>11</sub>は0ないし7の整数を示す。但し、m<sub>11</sub>およびn<sub>11</sub>が同時に0であることはない)；W<sub>11</sub>は環内窒素原子上にV<sub>11</sub>と結合点を有する含窒素複素環基、

【0071】式

【化66】



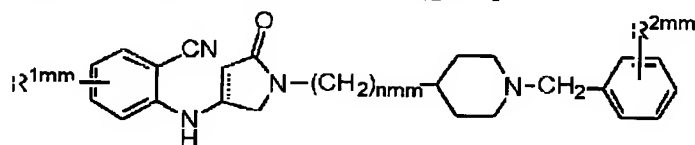
で表される基(式中、 $k11$ および $l11$ は同一または異なつて1ないし4、 $R_{411}$ は後記の $R_{511}$ および $R_{611}$ と同意義を有する)；上記一般式(211)において、環アルキレン基が5または6員環を形成するとき、該5または6員環中のエチレン基と1または2個のベンゼン環が縮合してなる基、または式： $-\text{NR}_{511}\text{R}_{611}$ で表される基(式中、 $R_{511}$ および $R_{611}$ はそれぞれ、水素原子、下記置換基群A11より選択される基、または下記置換基群A11より選択された1ないし3個の置換基(同一または異なつて)をそれぞれ有していてもよいアリール基、アリールカルボニル基、アラルキル基、複素環基若しくは複素環アルキル基を示す。)を示す。

置換基群A11：低級アルキル基、シクロアルキル基、アリール基、複素環基、アラルキル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキルアミノ基、アリールアミノ基、ア

ミノ低級アルキル基、低級アルキルアミノアルキル基、低級アルキルアミノアルキル基、ニトロ基、シアノ基、スルフォニル基、低級アルキルスルフォニル基、ハロゲノアルキルスルフォニル基、低級アルカノイル基、アリールカルボニル基、アリールアルカノイル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲノ低級アルキル基、N-低級アルキル、N-シアノアミノ基、N-低級アルキルおよびN-メチルアミノメチル基。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-メチル-3-[3-(1-ベンジル-4-ピペリジル)プロピオニル]インドール、1-メチル-3-[3-[1-(3-フルオロベンジル)-4-ピペリジル]プロピオニル]-5-フルオロインドール、1-メチル-3-[3-[1-(2-クロロベンジル)-4-ピペリジル]プロピオニル]インダゾール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平6-41070号公報(EP-A-562832)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0072】14)式

【化67】

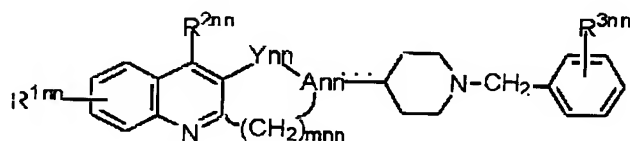


〔式中、 $R^{1mm}$ は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基またはアルキルチオ基； $R^{2mm}$ は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基またはアルコキシ基； $nmm$ は0~7の整数；破線は二重結合が存在してもよいことを示す。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、N-[1-[4-(1-ベンジルピペリジル)エチル]-2-オキソ-3-ピロリン-4-イル]-2-アミノベンズニトリル、N-[1-[4-

(1-ベンジルピペリジル)プロピル]-2-オキソ-3-ピロリン-4-イル]-2-アミノベンズニトリル等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-9188号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0073】15)式

【化68】



〔式中、  
【化69】



は、 $\text{>N-(CH}_2\text{)}_{nnn}\text{-}$ 、 $\text{>C=}$ 、 $\text{>C=CH(CH}_2\text{)}_{nnn}\text{-}$  または  $\text{>CH(CH}_2\text{)}_{nnn}\text{-}$  (ここで  $nnn$  は0~7の整数を示す)； $\text{Ynn}$ は  $\text{>C=O}$  または  $\text{>CHOH}$ ； $R^{1nn}$ は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基またはアルキルチオ基； $R^{2nn}$ は水素原子、ハロゲン原子、水酸基、アルキル基、アルコキシ基、置換基を有してもよいフェニル基、フェノキシ基、アルカノイルオキシ基または置換基を有してもよい

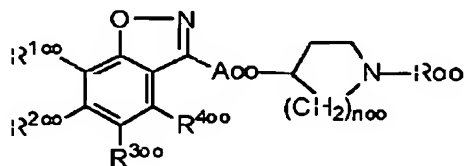
アミノ基； $R^{3nn}$ は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基またはアルコキシ基； $nnn$ は1~3の整数を示す。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、9-アミノ-2-[4-(1-ベンジルピペリジル)エチル]-2,3-ジヒドロピロロ[3,4-b]キノリン-1-オン、9-アミノ-2-[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]-1,2,3,4-テトラヒドロアクリジン-1-オン、9-メトキシ-2-[4-(1-ベンジルピペリジル)エチル]-2,3-ジヒドロピロロ[3,4-b]キノリン-1-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-279355号公報(EP-A-481429)



に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0074】16) 式

【化70】



〔式中、R<sub>00</sub>は水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキルアルキル、フェニルアルキル、ナフチルアルキル、シクロアルキルアルケニル、フェニルアルケニルまたはナフチルアルケニル；R<sup>100</sup>、R<sup>200</sup>、R<sup>300</sup>およびR<sup>400</sup>は同一または異なって、それぞれ水素、ハロゲン、アルキル、フェニル、フェニルアルキル、アルコキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、フェニルアルコキシ、フェノキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールオキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、-NHCO

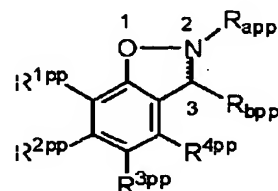
R<sup>500</sup>、-S(O)<sub>m00</sub>R<sup>500</sup>、-NHCO<sub>2</sub>R<sup>500</sup>、-CONR<sup>600</sup>R<sup>700</sup>、-NR<sup>600</sup>R<sup>700</sup>、-OCONR<sup>600</sup>R<sup>700</sup>、-OCSNR<sup>600</sup>R<sup>700</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>600</sup>R<sup>700</sup> または -COOR<sup>800</sup>；またはR<sup>100</sup>、R<sup>200</sup>、R<sup>300</sup>およびR<sup>400</sup>の隣接するものが相互に結合して、置換基を有してもよい-O(CH<sub>2</sub>)<sub>p00</sub>、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>q00</sub>O、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>r00</sub>N(R<sup>900</sup>)、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>s00</sub>CON(R<sup>900</sup>)、-N(R<sup>900</sup>)CO-CH=CH-またはベンゼン環若しくは複素芳香環を形成する基を示す（ここで、R<sup>500</sup>は、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキル；R<sup>600</sup>およびR<sup>700</sup>は同一または異なって、それぞれ水素、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキルを示すか、隣接する窒素原子を結合して複素環を形成する基；R<sup>800</sup>は、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキル；R<sup>900</sup>は、水素、アルキル、フェニルアルキルまたはアシル；m<sub>00</sub>は、0、1または2；p<sub>00</sub>、q<sub>00</sub>、r<sub>00</sub>およびs<sub>00</sub>は同一または異なって、1、2、または3を示す）；A<sub>oo</sub>は直鎖または分枝鎖状のアルキレン；n<sub>00</sub>は1、2、または3；上記定義中、アルキル、アルケニル、アルコキシ、フェニル、フェノキシ、シクロアルキルアルキル、フェニルアルキル、ナフチルアルキル、シクロアルキルアルケニル、フェニルアルケニル、ナフチルアルケニル、フェニルアルコキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、ベンゼン環および複素芳香環

は、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、-NHCO  
R<sup>500</sup>、-S(O)<sub>m</sub>。R<sup>500</sup>、-NHCO<sub>2</sub>R

R<sup>500</sup>、-CONR<sup>600</sup>R<sup>700</sup>、-NR<sup>600</sup>R<sup>700</sup>、-OCONR<sup>600</sup>R<sup>700</sup>、-OCSNR<sup>600</sup>R<sup>700</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>600</sup>R<sup>700</sup> または -COOR<sup>800</sup>（ここで、R<sup>500</sup>、R<sup>600</sup>、R<sup>700</sup>、R<sup>800</sup> および m<sub>00</sub>は上記と同義である）から選ばれる1ないし3個の置換基を有していてもよい。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6,7-ジメトキシ-1,2-ベンゾイソキサゾール、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6-(N-メチルアセトアミノ)-1,2-ベンゾイソキサゾール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-320160号公報（WO 93/04063）に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

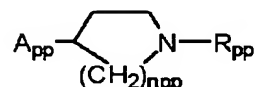
【0075】17) 式

【化71】



〔式中、2位と3位の間の結合が単結合を示すとき、R<sub>app</sub>は式

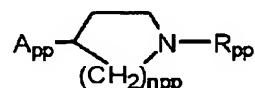
【化72】



〔式中、R<sub>pp</sub>は水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、フェニルアルキル、フェニルアルケニル、ナフチルアルキルまたはナフチルアルケニル；Appは直鎖または分枝鎖状のアルキレン；n<sub>pp</sub>は1、2、または3を示す〕により表される基を示し、R<sub>bpp</sub>は酸素を示す。

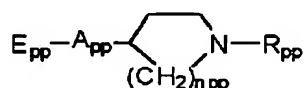
【0076】2位と3位の間の結合が二重結合を示すとき、R<sub>app</sub>は存在せず、R<sub>bpp</sub>は式

【化73】



〔式中の各記号は上記と同義である〕により表される基または式

【化74】



〔式中、E<sub>pp</sub>は酸素、硫黄を示し、他の各記号は上記と同義である〕により表される基；R<sup>1pp</sup>、R<sup>2pp</sup>、R<sup>3pp</sup>およびR<sup>4pp</sup>は同一または異なっ

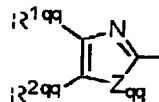
て、それぞれ水素、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、フェニル、フェニルアルキル、フェニルアルコキシ、フェノキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールオキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、 $-\text{NHCOR}^{5pp}$ 、 $-\text{S(O)}_{mpp} \text{R}^{5pp}$ 、 $-\text{NHSO}_2 \text{R}^{5pp}$ 、 $-\text{CONR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{NR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{OCSNR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$  または  $-\text{COOR}^{8pp}$  を示す。(R<sup>5pp</sup> は、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキル; R<sup>6pp</sup> および R<sup>7pp</sup> は同一または異なって、それぞれ水素、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキルを示すか、隣接する窒素原子と結合して複素環を形成する基; R<sup>8pp</sup> は、水素、アルキル、フェニルまたはフェニルアルキル; mpp は、0、1または2を示す; 上記定義中、アルキル、アルケニル、アルコキシ、フェニル、フェニルアルキル、フェニルアルケニル、フェニルアルコキシ、フェノキシ、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、ナフチルアルキル、ナフチルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシおよびヘテロアリールオキシは、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、 $-\text{NHCOR}^{5pp}$ 、 $-\text{S(O)}_{mpp} \text{R}^{5pp}$ 、 $-\text{NHSO}_2 \text{R}^{5pp}$ 、 $-\text{CONR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{NR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{OCONR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{OCSNR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^{6pp} \text{R}^{7pp}$  または  $-\text{COOR}^{8pp}$  (R<sup>5pp</sup>、R<sup>6pp</sup>、R<sup>7pp</sup>、R<sup>8pp</sup> および mpp は上記と同意義である) から選ばれる1ないし3個の置換基を有していてもよい。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6,7-ジメトキシ-1,2-ベンゾイソオキサゾール、6-ベンゾイルアミノ-2-[3-(1-ベンジル-4-ピペリジル)プロピル]-1,2-ベンゾイソオキサゾール-3(2H)-オン、6-ベンゾイルアミノ-2-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-1,2-ベンゾイソオキサゾール-3(2H)-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平6-41125号公報(WO 93/04063)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0077】18) 式

Mqq-Wqq-Yqq-Aqq-Qqq

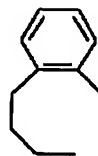
〔式中、Mqqは式：

【化75】

(式中、R<sup>1qq</sup> は水素、低級アルキル、置換基を有し

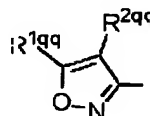
ていてもよい複素環基または置換基を有していてもよいアリール; R<sup>2qq</sup> は、水素、低級アルキル、置換基を有していてもよい複素環基または置換基を有していてもよいアリールを表わすか、または、R<sup>1qq</sup> と R<sup>2qq</sup> が互いに結合して、式：

【化76】



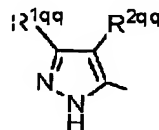
で表される基を形成; Zqqは、SまたはOをそれぞれ示す)で表される基、式：

【化77】



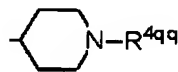
(式中、R<sup>1qq</sup> および R<sup>2qq</sup> は上記と同意義を示す)で表される基、または式：

【化78】



(式中、R<sup>1qq</sup> および R<sup>2qq</sup> は上記と同意義を示す)で表される基; Wqqは、結合、低級アルキレンまたは低級アルケニレン; Yqqは、低級アルキレン、 $-\text{NH}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CONR}^{3qq}-$  (式中、R<sup>3qq</sup> は水素または低級アルキルを示す)の基または式： $-\text{CHR}^{7qq}-$  (式中、R<sup>7qq</sup> はヒドロキシまたは保護されたヒドロキシを示す)の基; Aqqは、結合または低級アルキレン; Qqqは、式： $-\text{NR}^{8qq} \text{R}^{9qq}$  (式中、R<sup>8qq</sup> は低級アルキル; R<sup>9qq</sup> はアル(低級)アルキルを示す)の基または式：

【化79】



(式中、R<sup>4qq</sup> は低級アルキルまたは置換基を有していてもよいアル(低級)アルキルを示す)で表される基をそれぞれ示す。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、4-(ピリジン-3-イル)-5-メチル-2-[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]カルバモイル]チアゾール、2-[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]カルバモイル]-4-(4-クロロフェニル)-5-メチルチアゾール、5-[2-(1-ベンジルピペリジン-

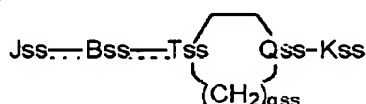
4-イル)エチル]カルバモイル]-3-(4-ニトロフェニル)ピラゾール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平5-345772号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0078】19)式

$R_{1rr} - Qrr - Zrr - Xrr - Arr - Mrr$   
 (式中、 $R_{1rr}$ は低級アルキル、置換基を有していてもよい複素環基、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアル(低級)アルキルまたはアル(低級)アルケニル;  $Qrr$ はオキサジアゾールジイル;  $Zrr$ は結合またはビニル;  $Xrr$ は結合、式:  $-CO-NR_{4rr}-$  (式中、 $R_{4rr}$ は水素または低級アルキルを示す)、式:  $-CHR_{8rr}-$  (式中、 $R_{8rr}$ はヒドロキシまたは保護されたヒドロキシを示す)、 $-COO-$  または  $-NHCO-$ ;  $Arr$ は結合、低級アルキレンまたは低級アルケニレン;  $Mrr$ は、低級アルキル、イミノ保護基および置換基を有していてもよいアル(低級)アルキルからなる群から選ばれる1個の置換基を有していてもよい少なくとも1個の窒素原子を含む複素環基をそれぞれ示す。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、5-(キヌクリジン-3-イル)-3-[[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]カルバモイル]-1,2,4-オキサジアゾール、3-[[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)エチル]カルバモイル]-5-(4-ニトロフェニル)-1,2,4-オキサジアゾール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平7-502529号公報(WO 93/13083)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

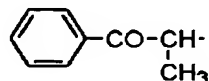
【0079】20)式

【化80】



(式中、 $Jss$ は(a)置換若しくは無置換の次に示す基; (1)フェニル基、(2)ピリジル基、(3)ピラジリル基、(4)キノリル基、(5)シクロヘキシル基、(6)キノキサリル基または(7)フリル基、(b)フェニル基が置換されていてもよい次の群から選択された一価または二価の基; (1)インダニル、(2)インデノニル、(3)インデニル、(4)インデノニル、(5)インダンジオニル、(6)テトラロニル、(7)ベンズスベロニル、(8)インダノリル、(9)式

【化81】



で示される基、(c)環状アミド化合物から誘導される一価の基、(d)低級アルキル基、または(e)式R

$1_{ss} - CH=CH-$  (式中、 $R_{1ss}$ は水素原子または低級アルコキシカルボニル基を意味する)で示される基を意味する。 $Bss$ は式  $-(CHR_{2ss})nss-$  で示される基、式  $-CO-(CHR_{2ss})nss-$  で示される基、式  $-NR_{3ss}-(CHR_{2ss})nss-$  (式中、 $R_{3ss}$ は水素原子、低級アルキル基、アシル基、低級アルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基またはベンジル基を意味する)で示される基、式  $-CO-NR_{4ss}-(CHR_{2ss})nss-$  (式中、 $R_{4ss}$ は水素原子、低級アルキル基またはフェニル基を意味する)で示される基、式  $-CH=CH-(CHR_{2ss})nss-$  で示される基、式  $-O-COO-(CHR_{2ss})nss-$  で示される基、式  $-O-CO-NH-(CHR_{2ss})nss-$  で示される基、式  $-NH-CO-(CHR_{2ss})nss-$  で示される基、式  $-CH_2-CO-NH-(CHR_{2ss})nss-$  で示される基、式  $-(CH_2)_2-CO-NH-(CHR_{2ss})nss-$  で示される基、式  $-C(OH)H-(CHR_{2ss})nss-$  で示される基(以上の式中、 $nss$ は0または1~10の整数を意味する。 $R_{2ss}$ は式  $-(CHR_{2ss})nss-$  で示されるアルキレン基が置換基を持たないか、または1つまたは1つ以上のメチル基を有しているような形で水素原子またはメチル基を意味する)、式  $=(CH-C(H)=CH)bss-$  (式中、 $bss$ は1~3の整数を意味する)で示される基、式  $=CH-(CH_2)c_{ss}-$  (式中、 $c_{ss}$ は0または1~9の整数を意味する)で示される基、式  $=(CH-CH)d_{ss}=$  (式中、 $d_{ss}$ は0または1~5の整数を意味する)で示される基、式  $-CO-CH=CH-CH_2-$  で示される基、式  $-CO-CH_2-C(OH)H-CH_2-$  で示される基、式  $-C(CH_3)H-CO-NH-CH_2-$  で示される基、式  $-CH=CH-CO-NH-(CH_2)_2-$  で示される基、式  $-NH-$  で示される基、式  $-O-$  で示される基、式  $-S-$  で示される基、ジアルキルアミノアルキルカルボニル基または低級アルコキシカルボニル基を意味する。

【0080】 $Tss$ は窒素原子または炭素原子を意味する。 $Qss$ は窒素原子、炭素原子または式  $>N \rightarrow O$  で示される基を意味する。 $Kss$ は水素原子、置換若しくは無置換のフェニル基、フェニル基が置換されていてもよいアリールアルキル基、フェニル基が置換されていてもよいシナミル基、低級アルキル基、ピリジリルメチル基、シクロアルキルアルキル基、アダマンタンメチル基、フリルメチル基、シクロアルキル基、低級アルコキシカルボニル基またはアシル基を意味する。 $q_{ss}$ は1~3の整数を意味する。式中、

【化82】

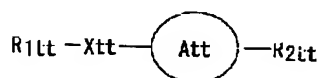


は単結合若しくは二重結合を意味する。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-ベンジル-4

—[(5,6-ジメトキシ-1-インダノン)-2-イル]メチルピペリジン、N-[4'-(1'-ベンジルピペリジル)エチル]-2-キノキサリンカルボン酸アミド、4-[4'-(N-ベンジル)ピペリジル]-p-メトキシブチロフェノン、1-[4'-(1'-ベンジルピペリジン)エチル]-1,2,3,4-テトラヒドロ-5H-1-ベンツアゼピン-2-オン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開昭64-79151号公報(USP 4,895,841)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

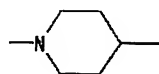
【0081】21)式

【化83】



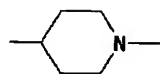
〔式中、 $R_{1tt}$ は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、ピラジン、インドール、アントラキノ、キノリン、置換基を有していてもよいフタルイミド、ホモフタルイミド、ピリジんカルボン酸イミド、ピリジン-N-オキサイド、ピラジンカルボン酸イミド、ナフタレンジカルボン酸イミド、置換基を有していてもよいキナゾリジンジオン、1,8-ナフタルイミド、ビスクロ[2.2.2]オクト-5-エン-2,3-ジカルボン酸イミドおよびピロメイルイミドから選ばれるものから誘導される一価の基； $X_{tt}$ は式  $-(CH_2)_{mtt}-$  (式中、 $mtt$ は0~7の整数を示す)で示される基、式  $-O(CH_2)_n tt-$  で示される基、式  $-S(CH_2)_n tt-$  で示される基、式  $-NH(CH_2)_n tt-$  で示される基、式  $-SO_2 NH(CH_2)_n tt-$  で示される基、式  $-NHCO(CH_2)_n tt-$  で示される基、式  $-NH(CH_2)_n tt-CO-$  で示される基、式  $-COO(CH_2)_n tt-$  で示される基、式  $-CH_2 NH(CH_2)_n tt-$  で示される基、式  $-CONR_{3tt}-(CH_2)_n tt-$  で示される基 ( $X_{tt}$ の定義中、これまでの式で $n$ はいずれも1~7の整数、 $R_{3tt}$ は低級アルキルまたはベンジル基を意味する)、式  $-O-CH_2 CH_2 CH(CH_3)-$  で示される基、式  $-O-CH(CH_3)CH_2 CH_2-$  で示される基、式  $-O-CH_2 CH_2 CH=$  で示される基、式  $-O-CH_2 CH(OH)CH_2-$  で示される基；環Attは式

【化84】



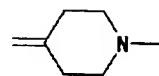
で示される基、式

【化85】



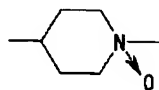
で示される基、式

【化86】



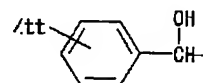
で示される基、または式

【化87】



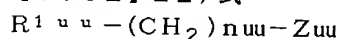
で示される基； $R_{2tt}$ は水素原子、低級アルキル基、置換基を有していてもよいベンジル基、置換基を有していてもよいベンゾイル基、ピリジル基、2-ハイドロキシエチル基、ピリジルメチル基、または式

【化88】



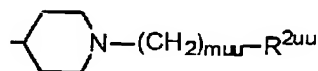
(式中、 $Z_{tt}$ はハロゲン原子を意味する)で表される基を示す。〕で表される化合物またはその塩。具体例としては、N-メチル-N-[2-(1'-ベンジルピペリジン-4'-イル)エチル]-4-ベンジルスルホニルベンツアミド、N-[2-(N'-ベンジルピペリジン-4'-イル)エチル]-4-ニトロフタルイミド、N-[2-(N'-ベンジルピペリジン-4'-イル)エチル]-1,8-ナフタルイミド等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開昭62-234065号公報(EPA-229391)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0082】22)式



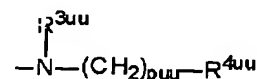
〔式中、 $R^{1uu}$ は置換基を有していてもよい環状アミド化合物から誘導される基； $nuu$ は0または1~10の整数； $Z_{uu}$ は、①式

【化89】



(式中、 $R^{2uu}$ は置換基を有していてもよいアリール基、シクロアルキル基または複素環基； $muu$ は1~6の整数を意味する)で示される基、または②式

【化90】

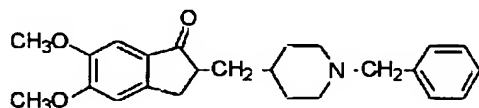


(式中、 $R^{3uu}$ は水素原子または低級アルキル基； $R^{4uu}$ は置換基を有していてもよいアリール基、シクロアルキル基または複素環基； $puu$ は1~6の整数を意味する)で示される基を意味する。但し、 $R^{1uu}$ の定義における置換基を有していてもよい環状アミド化合物がキナゾリジン-オンまたはキナゾリジン-ジオンである

場合、Zuuの定義において、R<sup>2</sup> および R<sup>4</sup> がアリアル基である場合は除く。) で表される化合物またはその塩。具体例としては、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-5-メトキシ-2H-3,4-ジヒドロ-1,3-ベンツオキサジン-2-オン、3-[2-[1-(4-ピリジリメチル)-4-ピペリジル]エチル]-2H-3,4-ジヒドロ-1,3-ベンツオキサジン-2-オン、3-[2-[1-(1,3-ジオキサラン-2-イルメチル)-4-ピペリジル]エチル]-5-メトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロキナゾリン-2,4-ジオン、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6-メトキシ-2H-3,4-ジヒドロ-1,3-ベンツオキサジン-2,4-ジオン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-235161号公報(EPA-468187)に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

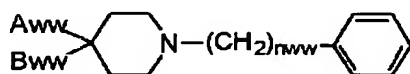
【0083】23)式

【化91】

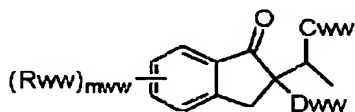


で表される光学活性インダノン誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平4-21670号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。24)式

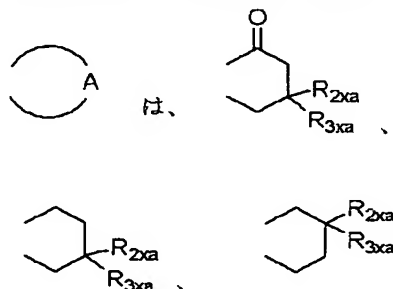
【化92】



【式中、nwwは0または1~2の整数；Awwは式【化93】

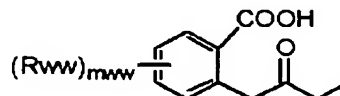


【式中、Cwwは水素原子またはヒドロキシ基；Dwwは水



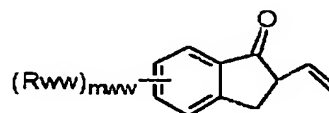
【式中、R<sub>2xa</sub>およびR<sub>3xa</sub>はそれぞれ低級アルキル基を意味する。)を意味する。】で表される化合物またはその塩。具体例としては、9-アミノ-6-クロロ-3,

素原子または低級ヒドロキシアルキル基；Rwwは同一または異なって水素原子、低級アルキル基および低級アルコキシ基から選ばれる基；mwwは0または1~4の整数を意味する)で表される基、または式【化94】



【式中、各記号は上記と同意義】で表される基；Bwwは水素原子またはヒドロキシ基を示し；AwwとBwwが二重結合を形成し、式

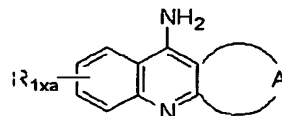
【化95】



【式中、各記号は上記と同意義】で表される基を形成してもよい。)で表される化合物またはその塩。具体例としては、1-ベンジル-4-(5,6-ジメトキシ-1-インダノン-2-イル)ヒドロキシメチルピペリジン、1-ベンジル-4-(5,6-ジメトキシ-2-ヒドロキシメチル-1-インダノン-2-イル)メチルピペリジン、1-ベンジル-4-[3-(4,5-ジメトキシ-2-カルボキシフェニル)-2-オキソ]プロピルピペリジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平9-268176号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

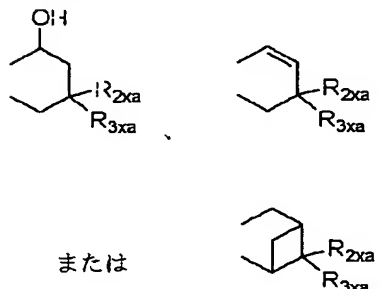
【0084】25)式

【化96】



【式中、R<sub>1xa</sub>は水素、ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルキル基またはモノ(またはジまたはトリ)ハロ(低級)アルキル基、

【化97】



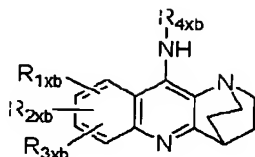
または

3-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロアクリジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平2-167267号公報に記載の方法またはそれに準じ

た方法により製造される。

【0085】26) 式

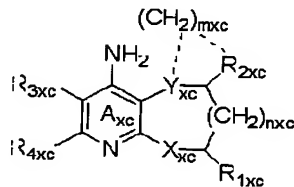
【化98】



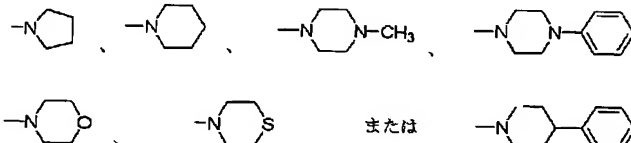
〔式中、 $R_{1xb}$ 、 $R_{2xb}$ および $R_{3xb}$ はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基、低級アルキル基、低級シクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシメチル基、低級アルキルチオ基、ニトロ基、アミノ基、低級アルカノイルアミノ基、低級アルキルアミノ基、ヒドロキシル基、フェニル基またはハロゲン原子、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたフェニル基を表わし、 $R_{4xb}$ は水素原子、低級アルキル基、アラルキル基、ジアラルキル基、または式 $R_{5xb}-CO-$ で表される基 ( $R_{5xb}$ は低級アルキル基、低級シクロアルキル基、アラルキル基、フェニル基またはハロゲン原子、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたフェニル基を表わす。)を表わす。〕で表されるアミノアザクリジン誘導体またはその塩。具体例としては、9-アミノ-8-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-エタノ-1-アザクリジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開昭63-166881号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0086】27) 式

【化99】



〔式中、 $R_{1xc}$ は、水素原子または低級アルキル基を、 $R_{2xc}$ は独立して水素原子若しくは、低級アルキル基を

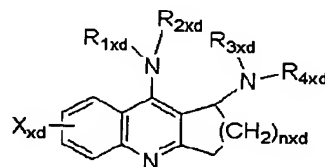


を構成する。〕で表される化合物、その立体異性体またはその塩。具体的には、1-(1-ピペリジニル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-アクリジナミンやN-1-エチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 9-アクリジンジアミン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平3-153667号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

示すか、または $R_{6xc}$ と一緒に環状のアルキレン鎖を示す。 $R_{3xc}$ および $R_{4xc}$ は、独立して各々水素原子を示すか、または一緒に環 $A_{xc}$ とともにキノリン環若しくは、テトラヒドロキノリン環を構成する。 $X_{xc}$ は酸素原子、硫黄原子または $N-R_{5xc}$ を示し、 $R_{5xc}$ は水素原子、または低級アルキル基を示す。 $Y_{xc}$ は酸素原子または $N-R_{6xc}$ を示し、 $R_{6xc}$ は独立して、水素原子若しくは低級アルキル基を示すか、または $R_{2xc}$ と一緒に環状アルキレンを示す。 $nxc$ は0または1を、 $mxc$ は0~4の整数を示す。〕で表される化合物またはその塩。具体的には、4'-アミノキノリノ〔2, 3-b〕-4-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 4-オキサジンや4'-アミノ-5', 6', 7', 8'-テトラヒドロキノリノ〔2, 3-b〕-4-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 4-オキサジン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平2-96580号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

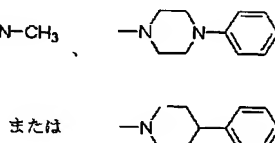
【0087】28) 式

【化100】



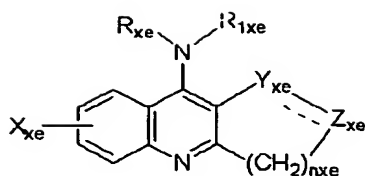
〔式中、 $nxd$ は1, 2または3であり、 $Xxd$ は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルであり； $R_{1xd}$ および $R_{2xd}$ はそれぞれ独立して水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルであるが、しかし両者は同時にアリール低級アルキルであることはできないものであり； $R_{3xd}$ および $R_{4xd}$ はそれぞれ独立して水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、ホルミルまたは低級アルキルカルボニルであるかまたは基 $-NR_{3xd}R_{4xd}$ が全体として次の基

【化101】



【0088】29) 式

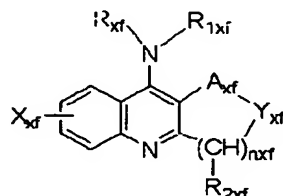
【化102】



[式中、 $n_{xe}$ は1, 2または3であり、 $X_{xe}$ は水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、 $NHCO R_{2xe}$  (ここで $R_{2xe}$ は $C_1 \sim C_6$ -アルキルである) または $NR_{3xe} R_{4xe}$  (ここで $R_{3xe}$ および $R_{4xe}$ は独立して水素または $C_1 \sim C_6$ -アルキルである) であり、 $R_{xe}$ は水素または $C_1 \sim C_6$ -アルキルであり、 $R_{1xe}$ は水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ジ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、アリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ジアリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、フリル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、チエニル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、酸素架橋されたアリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、酸素架橋されたジアリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、酸素架橋されたフリル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、または酸素架橋されたチエニル- $C_1 \sim C_6$ -アルキルであり、 $Y_{xe}$ は $C=O$ または $CR_{5xe}OH$  (ここで $R_{5xe}$ は水素または $C_1 \sim C_6$ -アルキルである) であり、そして $Z_{xe}$ は $CH_2$  または $C=CR_{6xe}R_{7xe}$  (ここで $R_{6xe}$ および $R_{7xe}$ は独立して水素または $C_1 \sim C_6$ -アルキルである) であるか、または $Y_{xe}$ と $Z_{xe}$ が一緒になって $CR_{5xe}=CH$  (ここで $CR_{5xe}$ および $CH$ はそれぞれ $Y_{xe}$ と $Z_{xe}$ に対応する) を構成するものとする。]で表される化合物、その光学対掌体またはその塩。具体的には、9-アミノ-3, 4-ジヒドロアクリジン-1 (2H)-オンまたは9-アミノ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロアクリジン-1-オール等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開昭61-148154号公報または特告平5-41141号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0089】30) 式

【化103】

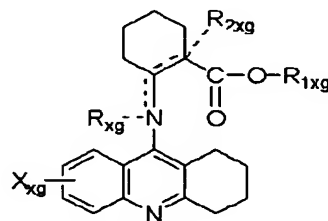


[式中、 $n_{xf}$ は1~4であり、 $R_{xf}$ は水素、低級アルキルまたは低級アルキルカルボニルであり、 $R_{1xf}$ は水素、低級アルキル、低級アルキルカルボニル、アリール、ジ低級アルキルアミノ低級アルキル、アリール低級アルキル、ジアリール低級アルキル、酸素架橋されたアリール低級アルキル、または酸素架橋されたジアリール

低級アルキルであり、 $A_{xf}$ は直接の結合または $(CH R_{3xf}) m_{xf}$ であり、 $m_{xf}$ は1~3であり、 $X_{xf}$ は水素、低級アルキル、シクロアルキル、低級アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、ホルミル、低級アルキルカルボニル、アリールカルボニル、 $-SH$ 、低級アルキルチオ、 $-NHCO R_{4xf}$  または $NR_{5xf} R_{6xf}$ であり、上記式中 $R_{4xf}$ は水素または低級アルキルであり、 $R_{5xf}$ および $R_{6xf}$ は各々独立して水素、低級アルキルまたはシクロアルキルであり、 $Y_{xf}$ は $O$ 、 $S$ または $NR_{7xf}$ であり、各 $R_{2xf}$ 、各 $R_{3xf}$ および $R_{7xf}$ は独立して水素若しくは低級アルキルであるか、または2つが同時に、少なくとも5つの原子からなる環の一部をなすメチレン若しくはエチレン基を形成し；但し $A_{xf}$ が $CH_2$ で、 $Y_{xf}$ が $NCH_3$ で、 $(CHR_{2xf}) n_{xf}$ が $CH_2CH_2$ で、 $X_{xf}$ が $H$ 、 $CH_3$ 、 $Cl$ 、 $Br$ または $NO_2$ で、 $R_{xf}$ が $H$ である場合には、 $R_{1xf}$ は $H$ 、メチル、エチル、プロピル、ブチルまたはベンジルではなく、 $A_{xf}$ が $-CH_2-$ または $CHR'-$ で、 $Y_{xf}$ が $NH$ または $NR'$ で、 $(CHR_{2xf}) n_{xf}$ が $-CH_2CH_2-$ または $CH_2CHR'-$ である場合には、基- $NR_{xf} R_{1xf}$ は $-NH_2$ 、 $-NHC_6H_5$ またはジ低級アルキルアミノ低級アルキルアミノではなく、各 $R'$ は独立して低級アルキルであり、 $A_{xf}$ が $CH_2$ で、 $Y_{xf}$ が $NH$ または $NR'$ で、 $(CHR_{2xf}) n_{xf}$ が $-(CH_2)_3-$ または $CHR'CH_2CH_2-$ である場合には、基- $NR_{xf} R_{1xf}$ は $-NH_2$ ではなく、 $A_{xf}$ が $-CH_2CH_2-$ で、 $Y_{xf}$ が $NH$ または $NR'$ で、 $(CHR_{2xf}) n_{xf}$ が $-CH_2CH_2-$ または $CHR'CH_2-$ である場合には、基- $NR_{xf} R_{1xf}$ は $-NH_2$ ではない。]で示される化合物、その立体、光学若しくは幾何異性体またはその塩。具体的には、9-アミノ-2, 3-ジヒドロチエノ

【0090】31) 式

【化104】

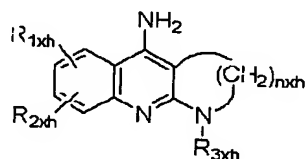


[式中、 $X_{xg}$ は水素、低級アルキル、低級アルコキシまたはハロゲンであり、 $R_{xg}$ は、存在する場合には、水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルであり、 $R_{1xg}$ は、水素、低級アルキルまたはアリール低級アル

キルであり；そして $R_{2xg}$ は、存在する場合には、水素または低級アルキルである。]で表される化合物またはその塩。具体的には、2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-アクリジニミノ)-シクロヘキサンカルボン酸や2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-アクリジニミノ)-シクロヘキサンカルボン酸エチルエステル等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平3-95161号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0091】32)式

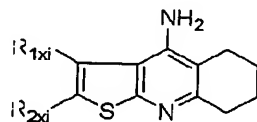
【化105】



[式中、 $R_{1xh}$ および $R_{2xh}$ はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシル基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基、ニトロ基、アミノ基または低級アルカノイルアミノ基を表わし、 $R_{3xh}$ は、水素原子；炭素数1~15のアルキル基；シクロアルキル基；ハロゲン、低級アルキル基若しくは低級アルコキシで置換されていてもよい炭素数7~15のアラルキル基；炭素数2~15のアルカノイル基；またはハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ、ヒドロキシル若しくはアミノで置換されていてもよいベンゾイル基を表わし、 $n \times h$ は2~5の整数を表わす。]で示される化合物またはその塩。具体的には、6-アミノ-1-ベンジル-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-アゼピノ[2, 3-b]キノリンや5-アミノ-6-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロベンゾ[d][1, 8]ナフチリジンが挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平3-220189号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0092】33)式

【化106】

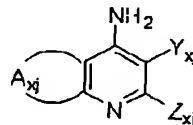


[式中、 $R_{1xi}$ 、 $R_{2xi}$ はそれぞれ水素原子、炭素数1~4の直鎖および分枝アルキル基を表わす。但しともに水素原子となることはない。]で示される4-アミノ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロチエノ[2, 3-b]キノリン誘導体またはその塩。具体的には、4-アミノ-2, 3-ジメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロチエノ[2, 3-b]キノリン等が挙げられる。上記化合物

またはその塩は、特開平4-134083号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

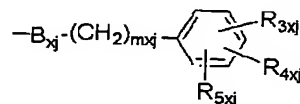
【0093】34)式

【化107】



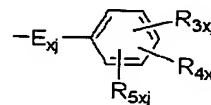
[式中、 $A_{xj}$ は式-( $CH_2$ ) $n \times j$ - (但し $n \times j$ は3~5の整数である)のアルキレン基を表わして、これに隣接するピリジン核の隣り合う2個の炭素原子に結合して1個のシクロアルケノ基を形成するか、若しくは $A_{xj}$ はこれに隣接するピリジン核の隣り合う2個の炭素原子と連合して1個のベンゼン環を形成する基であり、そして(i)  $A_{xj}$ がシクロアルケノ基を形成する場合には $Y_{xj}$ は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ の低級アルキル基またはアミノ基を表わし、かつ $Z_{xj}$ は水素原子、水酸基、ハロゲン原子、アミノ基、式-N $R_{1xj}R_{2xj}$  ( $R_{1xj}$ 、 $R_{2xj}$ は同一でも異なってもよく、低級アルキル基またはベンジル基を表わす)の基、ピロリジル基、ピペリジル基、ピペラジル基、N-置換ピペラジル基、ピリジル基または次式

【化108】



(式中、Bは酸素原子または硫黄原子を示し、 $m \times j$ は0~2の整数を示し、 $R_{3xj}$ 、 $R_{4xj}$ 、 $R_{5xj}$ は同一でも異なってもよく水素原子、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、直鎖または分枝の( $C_1 \sim C_6$ )低級アルキル基、アミノ基、アシルアミノ基を表わす)の基を示すかまたは $Z_{xj}$ はピリジルチオ基の基を示し、また(ii)  $A_{xj}$ がベンゼン環を形成する場合には、 $Y_{xj}$ は水素原子または $C_1 \sim C_6$ の低級アルキル基を示しかつ $Z_{xj}$ は式-CON $R_{6xj}R_{7xj}$  (但し $R_{6xj}$ および $R_{7xj}$ はそれぞれ水素原子または $C_1 \sim C_6$ の低級アルキル基を表わし、あるいは $R_{6xj}$ および $R_{7xj}$ は共同して $C_3 \sim C_6$ のシクロアルキル基を形成する)の基を示すか、または $Z_{xj}$ は式

【化109】



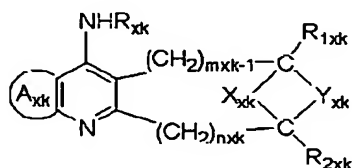
(式中、 $E_{xj}$ は $C_2 \sim C_6$ のアルキレン基または式-( $CH=CH$ ) $p \times j$ - (但し $p \times j$ は1または2を表わす)の基を示し、 $R_{3xj}$ 、 $R_{4xj}$ および $R_{5xj}$ は前期の意味を表わす)の基を示す。]で表される4-アミノ-



2, 3-シクロアルケノピリジンおよび4-アミノキノリン誘導体またはそれらの塩。具体的には、4-アミノ-2-(N-メチルカルバモイル)キノリン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-66571号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0094】35) 式

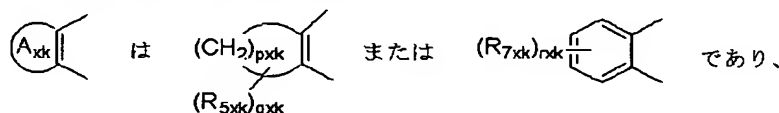
【化110】



〔式中、 $R_{xk}$ は水素、アルキル、アラルキルまたはアシルであり、 $R_{1xk}$ および $R_{2xk}$ は、独立して、水素、アルキル、アラルキル、アルコキシ、アルコシカルボニル、アミノまたは1または2個のアルキル、アラルキルまたはアシル基で置換されたアミノであり、 $m_{xk}$ および $n_{xk}$ は1、2または3の値であり、 $X_{xk}$ および $Y_{xk}$

$xk$ は、独立して、2個の炭素間の結合、酸素または硫黄原子、基 $N-R_{3xk}$ （式中基 $R_{3xk}$ は $R_{xk}$ について上記において定義した意味を有する）または1～5個の炭素原子を含有しかつ1または2以上の置換基 $R_{4xk}$ を含有できるアルキレンまたはアルケニレン架橋（ここで $R_{4xk}$ は、独立して、水素、1～4個の炭素原子を有する直鎖状若しくは分枝鎖状の低級アルキル、アルケニルまたはアルキリデン、フェニルまたは1または2以上の1～4個の炭素原子を有する低級アルキル基、1～4個の炭素原子を有する低級アルコキシ基またはハロゲン基で置換されたフェニル、アラルキル、1～4個の炭素原子を有する低級アルコキシ、およびヒドロキシルである）であり、そして $X_{xk}$ がアルケニレン基であるとき、後者は飽和若しくは不飽和の炭素環式または複素環式環系に融合することができ、上記環は1または2以上の基 $R_{5xk}$ （ $R_{5xk}$ は水素、1～4個の炭素原子を有する低級アルキルまたは低級アルコキシまたはハロゲンである）で置換することができ、そして

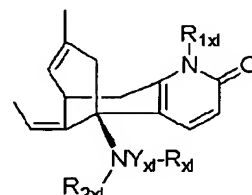
【化111】



$p_{xk}$ 、 $q_{xk}$ および $r_{xk}$ は1または1より大きい値であり、そして $R_{6xk}$ または $R_{7xk}$ は、独立して、水素、ハロゲン、低級アルコキシまたは低級アルキルであることができる置換基である。〕の多環式アミノピリジン化合物またはその塩。具体的には、(+)-12-アミノ-6, 7, 10, 11-テトラヒドロ-9-エチル-7, 11-メタノシクロオクタ[b]キノリンや(+)-12-アミノ-6, 7, 10, 11-テトラヒドロ-9-メチル-7, 11-メタノシクロオクタ[b]キノリン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特表平11-500144号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

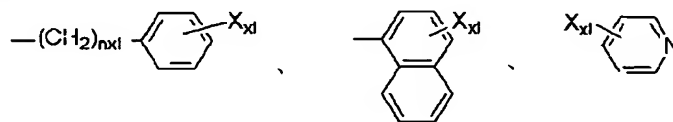
【0095】36) 式

【化112】



〔式中、 $Y_{x1}$ は $-C=O$ であるか、または $R_{2x1}$ 、 $Y$ は $=CH$ であり、 $R_{x1}$ は $C_1 \sim C_5$  低級アルキル、

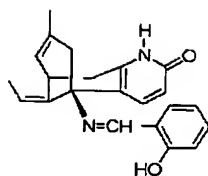
【化113】



（ここで、 $n_{x1}=0$ または1であり、 $X_{x1}$ は水素、 $C_1 \sim C_5$  低級アルキル、 $C_1 \sim C_5$  低級アルコキシ、ニトロ、ハロゲン、カルボキシ、アルコシカルボニル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシ、ビス- $C_1 \sim C_5$  低級アルキル置換アミノを表わす）、 $-(CH_2)_{m_{x1}}COOZ_{x1}$ （ここで、 $m_{x1}=0 \sim 5$ であり、 $Z_{x1}$ は水素または $C_1 \sim C_5$  低級アルキルを表わす）、 $-CH=CH-G_{x1}$ 基（ここで、 $G_{x1}$ はフェニル、フラニル、カルボキシ、アルコシカルボニルを表わす）、および窒素原子において $C_1 \sim C_5$  低級アル

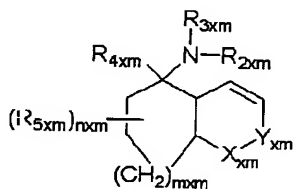
キルにより置換されたジヒドロ若しくはテトラヒドロピリジンを表わし、 $R_{1x1}$ は水素、 $C_1 \sim C_5$  低級アルキル、ピリドイルおよび $C_1 \sim C_5$  低級アルコキシ置換ベンゾイルを表し、 $R_{2x1}$ は水素および $C_1 \sim C_5$  低級アルキルを表わす。〕で表される化合物またはその塩。具体的には、下式の化合物等が挙げられる。

【化114】

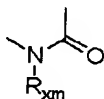


上記化合物またはその塩は、特表平10-511651号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

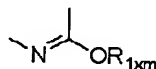
【0096】37) 式  
【化115】



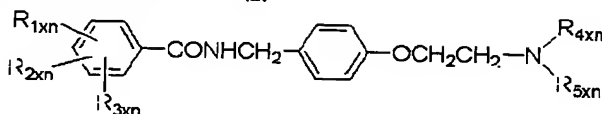
〔式中、Xxm-Yxmは、式  
【化116】



(式中、Rxmは水素、低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニルまたはアリール低級アルキルである)の基、または式  
【化117】

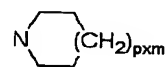


(式中、R1xnは水素、低級アルキルまたはアリール低

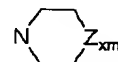


〔式中、R1xn、R2xnおよびR3xnはそれぞれ水素原子；低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、低級アルキル基が置換していても良いアミノ基、低級アルキル基が置換していても良いスルファモイル基を表わすか、若しくはR1xnおよびR2xnがいっしょになってメチレンジオキシ基を表わし、R4xnおよびR5xnはそれぞれ低級アルキル基または炭素数3から6個のシクロアルキル基、若しくはR4xnおよびR5xnがいっしょになってその置換する窒素原子と共に、それぞれ低級アルキル基が置換していても良い1-ピロリジニル基、1-ピペリジニル基、1-ピペラジニル基、4-モルホリニル基を表わす。〕で示される化合物またはその塩。具体的には、N-[4-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル]-2-エトキシベンズアミドや4-アミノ-N-[4-[2-(ジメ

級アルキルである)の基であり、R2xmおよびR3xmは、独立して水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、ジアリール低級アルキル、低級シクロアルケニル低級アルキル、低級アルコキシ、アリール低級アルコキシまたは低級アルカノイルであるか、またはR2xmおよびR3xmは、これらが結合している窒素原子と一緒に式  
【化118】



(式中、pxmは0または1である)の基、式  
【化119】

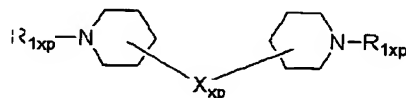


(式中、ZxmはO、Sまたは式NR6xm (R6xmは水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルである)の基である)の基を形成し、R4xmは水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルであり、R5xmは水素、低級アルキルまたはアリール低級アルキルであり、m xmは0、1または2であり、そしてnxmは1または2である。〕の化合物、その幾何学的および光学の異性体またはその塩。具体的には、N-(1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-5-メチル-2-オキソ-5-キノリニル)アセトアミドや5-[ [2-(3, 4-ジクロロフェニル)エチル]アミノ]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1-メチル-2(1H)-キノリノン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-290872号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

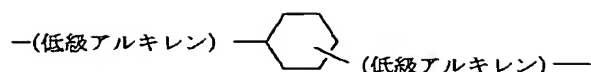
【0097】38) 式  
【化120】

チルアミノ)エトキシ]ベンジル]-2-メトキシ-5-スルファモイルベンズアミド等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平2-231421号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

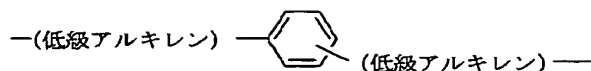
【0098】39) 式  
【化121】



〔式中、Xxpは炭素数1~10の直鎖または分枝状のアルキレン、  
【化122】



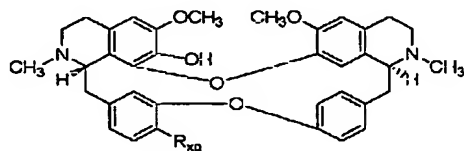
または、  
【化123】



を表す。 $R_{1xr}$ は $Ar \times p - CHR_{2xr}$ —(但し $Ar \times p$ は無置換のフェニル基またはハロゲン原子、トリフルオロメチル基、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたフェニル基を表わし、 $R_{2xr}$ は水素原子または低級アルキル基を表わす。)、フェニル基が無置換またはハロゲン原子、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたシンナミル基、シクロアルキルメチル基または複素環芳香族基で置換されたメチル基を表わす。また、Xの2つのピペリジン環への結合部位は一方が2位なら他方は2'位、一方が3位なら他方は3'位、一方が4位なら他方は4'位である。]で示される化合物またはその塩。具体的には、1, 6-ジ—(1-ベンジル—4-ピペリジル)ヘキサンや1, 5-ジ—(1-ベンジル—4-ピペリジル)ペンタン等が挙げられる。上記化合物またはその塩は、特開平4-18071号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0099】40) 式

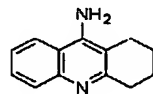
【化124】



[式中、 $R_{xq}$ は水酸基またはメトキシ基を示す。]で示される化合物またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平4-159225号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0100】41) 下式で表される9-アミノ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロアクリジンまたはその塩。

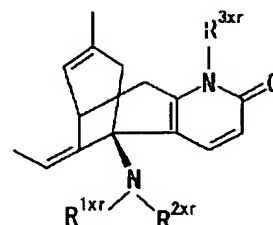
【化125】



上記化合物またはその塩は、特開平4-346975号公報に記載の方法、該公報に引用された文献記載の方法、またはそれらに準じた方法により製造される。

【0101】42) 式

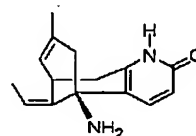
【化126】



[式中、 $R^{1xr}$ 、 $R^{2xr}$ および $R^{3xr}$ はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を示す。]で表される化合物またはその塩。

【0102】下式で表されるフベルジンA (Huperzine A) またはその塩。

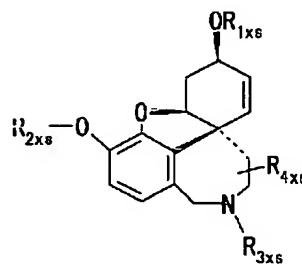
【化127】



上記化合物またはその塩は、USP 5,177,082、J. Am. Chem. Soc., 1991, 113, p4695-4696、または、J. Am. Chem. Soc., 1989, 111, p4116-4117に記載の方法またはそれらに準じた方法により製造されるか、あるいは、中草薬の千層塔(トウゲシバ)から抽出後、分離して得られる。

【0103】43) 下式の構造を有しているガラントミンあるいはガラントミンの誘導体

【化128】

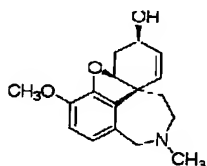


上式において $R_{1xs}$ および $R_{2xs}$ は同一のもの若しくは異なるものであり、それぞれ水素原子あるいは低級アルカノイル基のようなアシル基を意味しており、例えばアセチル基であり、あるいは例えばメチル、エチル、プロピルまたはイソプロピル等の直鎖あるいは枝分かれしたアルキル基である。 $R_{3xs}$ は直鎖または枝分かれしたアルキル基、アルケニル基あるいはアルカリル(alkaryl)基であり、これらの基は任意にハロゲン原子、あるいはシクロアルキル基、水酸基、アルコキシ基、ニトロ基、

アミノ基、アミノアルキル基、アシルアミノ基、ヘテロアリール基、ヘテロアリール-アルキル基、アロイル基、アロイルアルキル基、あるいはシアノ基により置き換えられるものであり、 $R_4$  又は四つの環状骨格を形成している炭素の少なくとも一つに結合している水素原子あるいはハロゲン原子を意味している。但し  $R_4$  が窒素原子に隣接した位置に存在している場合は、 $R_4$  は好ましくはハロゲン原子、ならびに例えば臭化水素酸塩、塩酸塩等のハロゲンの塩、硫酸メチルあるいはメチオサイドとは異なるものであることを条件とする。

【0104】具体的には、下式で表される Galantamine またはその塩が挙げられる。

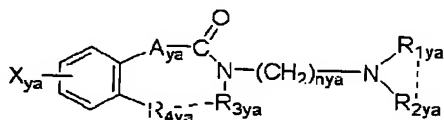
【化129】



上記化合物またはその塩は、特表平6-507617号、Heterocycles, 1977, 8, p277-282、または、J. Chem. Soc. (C), 1971, p1043-1047に記載の方法またはそれに準じた方法により製造されるか、あるいは、*Galanthus nivalis*や*Galanthus waronowii*等のユリ科植物から抽出後、分離して得られる。

【0105】44)式

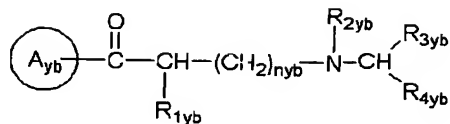
【化130】



〔式中、 $R_{1ya}$ と $R_{2ya}$ は、それぞれ独立して、水素原子または、置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すか、あるいは、隣接する窒素原子とともに縮合複素環系を形成し、 $R_{3ya}$ と $R_{4ya}$ は、 $R_{3ya}$ が水素原子または、それぞれ置換基を有していてもよい炭化水素残基若しくはアシル基を示し、 $R_{4ya}$ が水素原子を示すか、あるいは、 $R_{3ya}$ と $R_{4ya}$ が結合して  $-(CH_2)_{mya}-CO-$ 、 $-CO-(CH_2)_{mya}-$ または  $(CH_2)_{mya+1}-$  (式中、 $mya$ は0、1または2を示す) を形成し、 $A_{ya}$ は  $-(CH_2)_{lya}-$  (式中、 $lya$ は0、1または2を示す) または、 $-CH=CH-$  を示し、 $X_{ya}$ は1以上の置換基を示し、 $nya$ は4ないし7の整数を示す。〕で表わされる置換アミン類またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平2-91052号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0106】45) 式

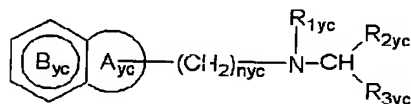
【化131】



〔式中、環 $A_{y,b}$ は置換されていてもよく、環構成ヘテロ原子としてO, S, Nの1〜2個を含んでもよい5〜8員環状基を示し、 $R_{1,y,b}$ は水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素残基を示し、 $R_{2,y,b}$ は水素原子または低級アルキル基を示し、 $R_{3,y,b}$ は置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 $R_{4,y,b}$ は水素原子または低級アルキル基若しくは置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 $n_{y,b}$ は2〜7の整数を示す。〕で表されるアミノケトン誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平3-95143号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0107】46)式

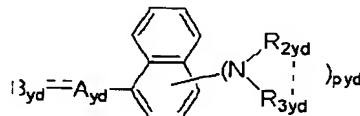
【化132】



〔式中、 $R_{1yc}$  は水素原子または低級アルキル基を示し、 $R_{2yc}$  は置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 $R_{3yc}$  は水素原子または低級アルキル基若しくは置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 $nyc$  は 0 ～ 7 の整数を示し、環  $A_y$  は置換されていてもよく、環構成ヘテロ原子として O、S の 1 または 2 個を含んでもよい 5 ～ 8 員環状基を示し、環  $B_y$  は置換されていてもよいベンゼン環を示す。〕で表されるアラルキルアミン誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平 3-141244 号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0108】47)式

【化133】



〔式中、 $B_{yd}$  は置換されていてもよい飽和または不飽和の5〜7員アザ複素環状基を示し、 $A_{yd}$  は結合手または炭化水素残基、オキソ基、ヒドロキシイミノ基若しくはヒドロキシ基で置換されていてもよい二価または三価の脂肪族炭化水素残基を示し、

【化134】

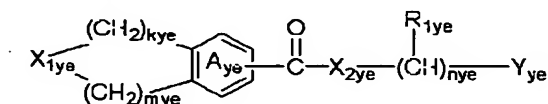
は単結合若しくは二重結合を示し（但し、 $A_{y,d}$  が結合手を表わすときは、

【化135】

は単結合を表わす)、 $R_{2ye}$ 、 $R_{3ye}$ はそれぞれ独立して水素原子若しくは置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すかまたは、隣接する窒素原子とともに環状アミノ基を形成してもよく、 $pyd$ は1または2を示す。)で表されるアミノナフタレン化合物またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平3-223251号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0109】48)式

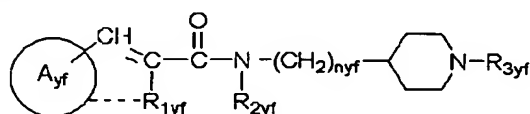
【化136】



〔式中、 $X_{1ye}$ は $R_{4ye}-N$  ( $R_{4ye}$ は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基または置換基を有していてもよいアシル基を示す)、酸素原子または硫黄原子を示し、 $X_{2ye}$ は $R_{5ye}-N$  ( $R_{5ye}$ は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基または置換基を有していてもよいアシル基を示す) または酸素原子を示し、 $A_{ye}$ 環はさらに置換基を有していてもよいベンゼン環を示し、 $R_{1ye}$ は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基を示し、 $R_{1ye}$ は $nye$ の繰り返しにおいてそれぞれ異なってもよく、 $Y_{ye}$ は置換されていてもよいアミノ基または置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基を示し、 $nye$ は1ないし10の整数を、 $k_{ye}$ は0ないし3の整数を、 $mye$ は1ないし8の整数を示す。)で表される縮合複素環カルボン酸誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平5-239024号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。

【0110】49)式

【化137】



〔式中、環 $A_{yf}$ は置換基を有していてもよい芳香環を示し、 $R_{1yf}$ は水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すか、あるいは隣接する基- $CH=C$ -および環 $A_{yf}$ を構成する2個の炭素原子とともに置換されていてもよい炭素環を形成し、 $R_{2yf}$ は水素原子または置換基を有していてもよい炭化水素残基若しくはアシル基を示し、 $R_{3yf}$ は置換基を有していてもよい炭化水素残基を示し、 $nyf$ は2から6の整数を示す。)で表わされる不飽和カルボン酸アミド誘導体またはその塩。上記化合物またはその塩は、特開平2-138255号公報に記載の方法またはそれに準じた方法により製造される。なお、上記の各種非カーバメート系アミン化合物は、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用

を有するので、殺虫作用も有する。

【0111】「排尿障害を引き起こす疾患を治療する薬剤」としては、前立腺肥大症の治療薬、前立腺癌の治療薬、膀胱頸部硬化症の治療薬、慢性膀胱炎の治療薬、便秘の治療薬、大腸癌の治療薬、子宮癌の治療薬、糖尿病の治療薬、脳血管障害の治療薬、脊髄損傷の治療薬、脊髄腫瘍の治療薬、多発性硬化症の治療薬、アルツハイマー病を含む痴呆症の治療薬、パーキンソン病の治療薬、進行性核上性麻痺の治療薬、ギラン-バレー症候群の治療薬、急性汎自律神経異常症の治療薬、オリーブ橋小脳萎縮症の治療薬、頸椎症の治療薬などが挙げられる。

【0112】前立腺肥大症の治療薬としては、例えば、Allylestrenol、Chlormadinone acetate、Gestonorone caproate、Norgestrol、Mepartirin、Finasteride、P A-109、THE-320などが挙げられる。また、前立腺肥大に伴う排尿障害の治療薬として、YM-31758、YM-32906、KF-20405、MK-0434、フィナステリド、CS-891などの $\alpha$ -リダクターゼ阻害薬などが挙げられる。前立腺癌の治療薬としては、例えば、Ifosfamide、Estramustine phosphate sodium、Cyproterone、Chlormadinone acetate、Flutamide、Cisplatin、Lonidamine、Peplomycin、Leuprolerin、Finasteride、Triptorelin-DDS、Buserelin、Goserelin-DDS、Fenretinide、Bicalutamide、Vinorelbine、Nilutamide、Leuprolide-DDS、Deslorelin、Cetorelix、Ranpirnase、Leuprolerin-DDS、Satraplatin、Prinomastat、Exisulind、Buserelin-DDS、Abarelix-DDSなどが挙げられる。膀胱頸部硬化症の治療薬としては、例えば、 $\alpha$ 1遮断剤などの $\alpha$ 遮断剤などが挙げられる。 $\alpha$ 遮断剤としては、例えば、タムスロシン (Tamsulosin)、プラゾシン (Prazosin)、テラゾシン (Terazosin)、ドキサゾシン (Doxazosin)、ウラピジル (Urapidil)、インドラミン (Indoramin)、アルフゾシン (Alfuzosin)、ダピプラゾール (Dapiprazole)、ナフトピジル (Naftopidil)、Ro 70-0004、KMD-3213、GYKI-16084、JTH-601、Z-350、Rec-15-2739、SK&F-86466、ブナゾシン (Bunazosin)、BMJ-15037、ブフロメジル (Buflomedil)、ネルダゾシン (Neldazosin)、Moxisylyte、SL-890591、LY-23352、ABT-980、AIO-8507-L、L-783308、L-780945、SL-910893、GI-231818、SK&F-106686、RWJ-38063、セロドシン、フィドキシシン (Fiduxosin)などが挙げられる。慢性膀胱炎の治療薬としては、例えば、Flavoxate hydrochlorideなどが挙げられる。便秘の治療薬としては、例えば、Sennoside A・B、Phenolalなどが上げられる。大腸癌の治療薬としては、例えば、Chromomycin A3、Fluorouracil、Tegafur、Krestinなどが挙げられる。子宮癌の治療薬としては、例えば、Chromomycin A3、Fluorouracil、Bleomycin hydrochlor

ide、Medroxyprogesterone acetateなどが挙げられる。

【0113】糖尿病の治療薬としては、例えばインスリン抵抗性改善薬、インスリン分泌促進薬、ビッグアニド剤、インスリン、 $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害薬、 $\beta$ 3アドレナリン受容体作動薬などが挙げられる。インスリン抵抗性改善薬としては、例えばピオグリタゾンまたはその塩（好ましくは塩酸塩）、トログリタゾン、ロシグリタゾンまたはその塩（好ましくはマレイン酸塩）、JTT-501、GI-262570、MCC-555、YM-440、DRF-2593、BM-13-1258、KRP-297、CS-011などが挙げられる。インスリン分泌促進薬としては、例えばスルフォニル尿素剤が挙げられる。該スルフォニル尿素剤の具体例としては、例えばトルブタミド、クロルプロバミド、トラザミド、アセトヘキサミド、グリクロピラミドおよびそのアンモニウム塩、グリベンクラミド、グリクラジド、グリメピリドなどが挙げられる。上記以外にも、インスリン分泌促進剤としては、例えばレバグリニド、ナテグリニド、KAD-1229、JTT-608などが挙げられる。ビッグアニド剤としては、例えばメトホルミン、ブホルミンなどが挙げられる。インスリンとしては、例えばウシ、ブタの膵臓から抽出された動物インスリン；ブタの膵臓から抽出されたインスリンから酵素的に合成された半合成ヒトインスリン；大腸菌、イーストを用い遺伝子工学的に合成したヒトインスリンなどが挙げられる。インスリンとしては、0.45から0.9 (w/w) %の亜鉛を含むインスリン亜鉛；塩化亜鉛、硫酸プロタミンおよびインスリンから製造されるプロタミンインスリン亜鉛なども用いられる。さらに、インスリンは、そのフラグメントあるいは誘導体（例、INS-1など）であってもよい。 $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害薬としては、例えばアカルボース、ボグリボース、ミグリトール、エミグリテートなどが挙げられる。 $\beta$ 3アドレナリン受容体作動薬としては、例えばAJ-9677、BMS-196085、SB-226552、SR-58611-A、CP-114271、L-755507などが挙げられる。上記以外にも、糖尿病治療薬としては、例えばエルゴセット、プラムリントイド、レプチン、BA Y-27-9955などが挙げられる。などが挙げられる。

【0114】脳血管障害の治療薬としては、例えば、Nicaraven、Bencyclane fumarate、Eurnamonine、Flunarizine、Nilvadipine、Ibutilast、Argatroban、Nizofenone、Naftidrofuryl、Nicergoline、Nimodipine、Papa veroline、Alteplase、Viquidil hydrochloride、Moxisylyte、Pentoxifylline、Dihydroergotoxine mesylate、Lemildipine、Cyclandelate、Xanthinol nicotinate、Febarbamate、Cinnarizine、Memantine、Ifenprodil、Meclofenoxate hydrochloride、Ebselen、Clopidogrel、Nebracetam、Edaravone、Clinprost-DDS、Vatanidipine、Ancrod、Dipyridamolなどが挙げられる。脊髄損

傷の治療薬としては、例えば、Methylprednisolone、Dural graft matrixなどが挙げられる。脊髄腫瘍の治療薬としては、例えば、Nimustine hydrochlorideなどが挙げられる。多発性硬化症の治療薬としては、例えば、Interferon- $\beta$ -1bなどが挙げられる。

【0115】アルツハイマー病を含む痴呆症の治療薬としては、例えば、Aniracetam、Arginine pyroglutamate、Nefiracetam、Nimodipine、Piracetam、Propenthylline、Vinpocetine、Indeloxazine、Vitamin E、Cinepazide、Memantine、Lisuride hydrogen malate、Pramiracetam、Zuclopenthixol、Protirelin、EGB-761、Acetyl-L-carnitine、Phosphatidylserine、Nebracetam、Taltireline、Choline alphoscerate、Ipidacrine、Talsac lidine、Cerebrolysin、Rofecoxib、ST-618、T-588、Tacrine、Physostigmine-DDS、Huperzine A、Donepezil、Rivastigmine、Metrifonate、TAK-147などが挙げられる。パーキンソン病の治療薬としては、例えば、Tali pexole、Amantadine、Pergolide、Bromocriptine、Selegiline、Mazaticol hydrochloride、Memantine、Lisuride hydrogen malate、Trihexyphenidyl、Piroheptin hydrochloride、Terguride、Ropinirole、Ganglioside-GM1、Droxidopa、Riluzole、Gabergoline、Entacapone、Rasagiline、Pramipexole、L-dopa-methylester、Tolcapone、Remacemide、Dihydroergocryptine、Carbidopa、Selegiline-DDS、Apomorphine、Apomorphine-DDS、Etilevodopa、Levodopaなどが挙げられる。進行性核上性麻痺の治療薬としては、例えば、L-ドーパ（L-dopa）、カルビドパ（carbidopa）、ブロモクリプチン（bromocriptine）、ペルゴリド（pergolide）、リスリド（lisuride）、アミトリプチン（amitriptyline）などが挙げられる。ギラン-バレー症候群の治療薬としては、例えば、ステロイド剤やプロチレリン（protireline）などのTRH製剤などが挙げられる。急性汎自律神経異常症の治療薬としては、例えば、ステロイド剤、ドロキシドパ（L-threo-DOPS）、ジヒドロエルゴタミン（dihydroergotamine）、アメジニウム（amezinium）などが挙げられる。オリブ橋小脳萎縮症の治療薬としては、例えば、TRH製剤、ステロイド剤あるいはミドドリン（midodrine）、アメジニウム（amezinium）などが挙げられる。頸椎症の治療薬としては、例えば、消炎鎮静薬などが挙げられる。

【0116】「他の疾患治療のために投与されるがそれ自体が排尿障害を惹起する薬剤」としては、例えば、鎮痛薬（モルヒネ、塩酸トラマドールなど）、中枢性骨格筋弛緩薬（バクロフェンなど）、ブチロフェノン系抗精神病薬（ハロペリドールなど）、頻尿・尿失禁治療薬（塩酸オキシブチニン、塩酸プロピベリン、トルテロジン、グリフェナシン、YM-905/YM-537、テミベリン（NS-21）、KRP-197、トロスピウムなどのムスカリン拮抗薬；塩酸フラボキサートなどの平滑筋弛緩薬；NC-1800など

の筋弛緩薬；クレンブトールなどのBeta2 アゴニスト；ZD-0947、NS-8、KW-7158、WAY-151616などのカリウムチャンネル開口薬；ONO-8711などのPGE2 アンタゴニスト；レジニフェラトキシシン、カプサイシンなどのバニロイド受容体アゴニスト；TAK-637、SR-48968 (saredutant)、SB-223412 (talnerant) などのタキキニン拮抗薬；デルタオピオイドアゴニストなど）、鎮痙薬（臭化ブチルスコポラミン、臭化ブトロピウム、臭化チキジウム、臭化チメピジウム、臭化プロパンテリンなど）、消化管潰瘍治療薬（コランテル、メサフィリン、シメチジンなど）、パーキンソン病治療薬（塩酸トリヘキシフェニジル、ピベリデン、塩酸マザチコール、レボドパなど）、抗ヒスタミン薬（ジフェンヒドラミン、マレイン酸クロルフェニラミン、塩酸ホモクロルシクリジンなど）、三環系抗うつ薬（塩酸イミプラミン、塩酸アミトリプチリン、塩酸クロミプラミン、アモキサピン、塩酸デシプラミンなど）、フェノチアジン系抗精神病薬（クロルプロマジン、プロペリシアジン、レボメプロマジン、チオリダジンなど）、ベンゾジアゼピン系精神安定薬・睡眠鎮静薬（ジアゼパム、クロルジアゼポキシド、クロチアゼパム、エスタゾラムなど）、抗不整脈薬（ジソピラミドなど）、血管拡張薬（塩酸ヒドララジンなど）、脳末梢循環改善薬（ペントキシフィリンなど）、気管支拡張薬（テオフィリン、塩酸エフェドリン、塩酸メチルエフェドリンなど）、 $\beta$ -アドレナリン遮断薬（塩酸プロプラノロールなど）、感冒薬（ダンリッチなど）、末梢性骨格筋弛緩薬（ダントロレンナトリウムなど）、抗結核薬（イソニアジドなど）などが挙げられる。これらの組み合わせのうち、8-[3-[1-[3-フルオロフェニル]メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オンまたはその塩の結晶とタムスロシン (Tamsulosin)、プラゾシン (Prazosin) などの $\alpha$ 遮断剤との組み合わせが好ましい。

【0117】非カルバメート系アミン化合物またはその塩と、排尿障害を引き起こす疾患を治療する薬剤もしくは排尿障害を惹起する薬剤とを併用して用いる場合、例えば（1）公知の製剤学的製造法に準じ、所望により適宜製剤学的に許容され得る賦形剤等と共に単一剤に製造する、（2）それぞれを所望により製剤学的に許容され得る賦形剤等を用いて各製剤とし同時または時差を設けて組み合わせて使用（併用）する、または（3）それぞれを常法により適宜賦形剤と共にそれぞれ製剤化したものをセット（キット剤等）等としてもよい。（2）の場合、本発明の目的が達成される限り、各製剤の投与回数は異なってもよい。このような製剤中の有効成分の含有量は、各々の有効成分の有効量の範囲内あるいは製剤学的、薬理学的に許容される範囲内であればよい。具体的には通常約0.01～約100重量%である。

【0118】（8）投与量

本発明の結晶および本発明の医薬組成物の投与量は、投与対象、投与ルート、疾患等により異なるが、例えば、排尿困難治療剤として、成人（体重約60kg）に対して、経口剤として、1回当たり有効成分として約0.005～100mg、好ましくは約0.05～30mg、さらに好ましくは約0.2～10mgであり、1日1回の投与でもよいし、数回に分けて投与することもできる。薬物を組み合わせて用いる場合には、個々の薬物の最少推奨臨床投与量を基準とし、投与対象、投与対象の年齢および体重、症状、投与時間、投与方法、剤型、薬物の組み合わせなどにより、適宜選択することができる。ある特定の患者の投与量は、年齢、体重、一般的健康状態、性別、食事、投与時間、投与方法、排泄速度、薬物の組み合わせ、患者のその時に治療を行っている病状の程度に応じ、それらあるいはその他の要因を考慮して決められる。典型的には、非カルバメート系アミン化合物またはその塩と、各種疾患治療薬から選ばれる少なくとも一種の化合物またはその塩との組み合わせに関する個々の一日投与量は、それらが単独で投与される場合の実態に関して最少推奨臨床投与量の約1/50以上最大推奨レベル以下の範囲である。

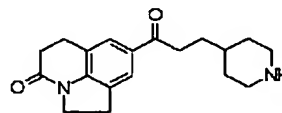
【0119】

【発明の実施の形態】以下に、参考例、実施例、製剤例および試験例を挙げて本発明をさらに詳細に説明するが、本発明はこれらにより限定されるものではない。また、以下の参考例および実施例において、%は特記しない限り重量パーセントを示す。融点はデュッヒ社製535型融点測定装置およびヤナコ機器開発研究所（株）社製MP-500Dを用いて測定した。粉末X線結晶回折のデータは、線源としてCu-K $\alpha_1$ 線を用い、RINT1100型（理学電気（株））を用いて測定した。

【0120】

【実施例】参考例1

8-[3-(4-ピペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン  
【化138】



1) 3-(1-アセチル-4-ピペリジニル)プロピオン酸 (8.2g, 0.0443mol) を、氷冷下、塩化チオニル(300mL)に少量ずつ加えた。室温で10分間攪拌後、減圧下、25°Cにて塩化チオニルを留去した。残渣にジエチルエーテルを加え、減圧留去して黄色固形物を得た。さらにジエチルエーテルを加え、固形物をスパーテルで粉碎し、減圧留去して、3-(1-アセチル-4-ピペリジニル)プロピオン酸クロリドの粗生成物を淡黄色粉末として得た。この淡黄色粉末および1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(64.0g, 0.369mol)を1,2-ジクロ

ロエタン(200mL)に懸濁し、塩化アルミニウム(162g, 1.21mol)を室温で少量ずつ加えた。室温で12時間攪拌した後、反応混合物を氷-水に加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、淡黄色油状物を得た。油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: 酢酸エチル-メタノール=9:1)で精製し、エタノール-ジエチルエーテルから結晶化させることにより、8-[3-(1-アセチル-4-ピペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン 123.5gを融点 157-159°Cの無色結晶として得た。

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.00-1.30 (2H, m), 1.50-1.95 (5H, m), 2.09 (3H, s), 2.53 (1H, dt,  $J=12.9, 2.4$  Hz), 2.72 (2H, t,  $J=7.6$  Hz), 2.90-3.15 (5H, m), 3.24 (2H, t,  $J=8.6$  Hz), 3.75-3.90 (1H, m), 4.14 (2H, t,  $J=8.6$  Hz), 4.55-4.70 (1H, m), 7.68 (1H, s), 7.73 (1H, s).

元素分析  $\text{C}_{21}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_3$  として

計算値: C, 71.16; H, 7.39; N, 7.90.

実験値: C, 71.12; H, 7.18; N, 7.80.

2) 1) で得た8-[3-(1-アセチル-4-ピペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(118.7g, 0.335mol)に濃塩酸(600 mL)を加え、140°Cで4時間攪拌した。室温まで冷却後、減圧下にて塩酸を留去し、得られた残査を8規定水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性( $\text{pH}>12$ )とし、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去し、酢酸エチル-ジエチルエーテルから結晶化させることにより、表題化合物 103.7gを融点 114-115°Cの無色結晶として得た。

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.00-1.30 (2H, m), 1.30-1.90 (7H, m), 2.59 (2H, dt,  $J=12.0, 2.4$  Hz), 2.72 (2H, t,  $J=7.6$  Hz), 2.85-3.15 (5H, m), 3.23 (2H, t,  $J=8.6$  Hz), 4.14 (2H, t,  $J=8.6$  Hz), 7.68 (1H, s), 7.73 (1H, s).

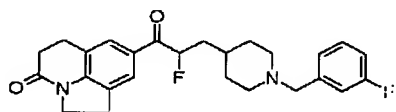
元素分析  $\text{C}_{19}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_2$  として

計算値: C, 73.05; H, 7.74; N, 8.97.

実験値: C, 72.96; H, 7.48; N, 9.15.

#### 【0121】参考例2

8-[2-フルオロ-3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン



窒素置換した三つ又フラスコに、1,1,1,3,3,3-ヘキサメ

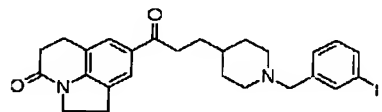
チルジシラザン(1.38g, 8.60mmol)のTHF(50mL)溶液を入れ、ドライアイス-アセトンバスにて冷却した。n-BuLiのヘキサン溶液(1.6M)(5.4mL, 8.6mmol)を滴下した後、溶液を-20°Cで10分間攪拌した。再びドライアイス-アセトンバスに移し、実施例1で得た8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(3.0g, 7.1mmol)のテトラヒドロフラン(20mL)溶液を滴下し、-20°Cで20分攪拌した。再びドライアイス-アセトンバスに移し、N-フルオロベンゼンスルホンイミド(1.38g, 8.6mmol)のテトラヒドロフラン(20mL)溶液を滴下し、室温まで自然昇温させた。反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残査をシリカゲルクロマトグラフィー(展開溶媒: 酢酸エチル)にて精製することにより、表題化合物を無色油状物(42mg)として得た。

$^1\text{H NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.20-1.40 (3H, m), 1.60-1.80 (4H, m), 1.85-2.00 (2H, m), 2.80-2.95 (2H, m), 2.93 (2H, t,  $J=7.5$  Hz), 3.25-3.45 (4H, m), 3.47 (2H, s), 4.18 (2H, t,  $J=8.7$  Hz), 5.21 (1H, dt,  $J=46.5, 6.6$  Hz), 6.90-7.10 (3H, m), 7.20-7.30 (1H, m), 7.73 (1H, s), 7.76 (1H, s).

#### 【0122】実施例1

8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン

#### 【化139】



参考例1で得た8-[3-(4-ピペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(103.7g, 0.332mol)のアセトニトリル(750mL)溶液に、3-フルオロベンジルブロミド(65.9g, 0.349mol)および無水炭酸カリウム(80g)を加え、室温で12時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチル(250mL)-テトラヒドロフラン(250mL)-水(200mL)混合溶液に加え、有機層を分離した。水層を酢酸エチル(80mL)-テトラヒドロフラン(50mL)で2回抽出した。有機層をまとめ、飽和食塩水(150mL)で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮して無色の粗結晶(130.6g)を得た。粗結晶の半分の量を約40°Cに温めながら酢酸エチル(140mL)-メタノール(10mL)-クロロホルム(150mL)に溶解し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(シリカゲル: 300g、展開溶媒: 酢酸エチル-メタノール=10:1)で精製した。同一の工程を繰り返



して、合計115.4gの粗結晶を得た。得られた結晶115.4gにエタノール(500mL)を加え、攪拌しながら均一な溶液になるまで加熱還流した。常圧下に加熱しながらエタノール(約250mL)を留去した後、加熱を止め、自然冷却させながら6時間攪拌した。析出した結晶を濾取し、冷エタノール(250mL)で洗浄後、室温で乾燥して、表題化合物111.3gを融点114-117°Cの無色結晶として得た。粉末X線結晶回折パターンを図1に示す。

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.20-1.50 (4H, m), 1.55-1.80 (4H, m), 1.85-2.05 (2H, m), 2.71 (2H, t, J=7.6 Hz), 2.80-3.15 (5H, m), 3.22 (2H, t, J=8.6 Hz), 3.47 (2H, s), 4.13 (2H, t, J=8.6 Hz), 6.85-7.15 (3H, m), 7.20-7.35 (1H, m), 7.67 (1H, s), 7.72 (1H, s).

元素分析値 C<sub>26</sub>H<sub>29</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>として

計算値: C, 74.26; H, 6.95; N, 6.66.

実験値: C, 74.28; H, 7.02; N, 6.58.

#### 【0123】粉末X線結晶回折のデータ

回折角: 2θ (°)	面間隔: d 値 (Å)
5.08	17.4
10.2	8.68
16.8	5.27
17.8	4.97
18.6	4.76
20.6	4.31
23.1	3.85

#### 【0124】製剤例1

(1) 実施例1の結晶 1g  
(2) 乳糖 197g  
(3) トウモロコシ澱粉 50g  
(4) ステアリン酸マグネシウム 2g  
上記(1)、(2)およびトウモロコシ澱粉(20g)を混和し、トウモロコシ澱粉(15g)と25mLの水から作ったペーストとともに顆粒化し、これにトウモロコシ澱粉(15g)と上記(4)を加え、混合物を圧縮錠剤機で圧縮して、錠剤1錠当たり実施例1の結晶を0.5mg含有する直径3mmの錠剤2000個を製造した。

#### 【0125】製剤例2

(1) 実施例1の結晶 2g  
(2) 乳糖 197g  
(3) トウモロコシ澱粉 50g  
(4) ステアリン酸マグネシウム 2g  
製剤例1と同様の方法により、錠剤1錠当たり実施例1の結晶を1.0mg含有する直径3mmの錠剤2000個を製造した。

#### 【0126】製剤例3

(1) 実施例1の結晶 5.0mg  
(2) 乳糖 60.0mg

保存期間(日)

重量変化率(%)

25°C/75%RH 25°C/93%RH

(3) トウモロコシ澱粉 35.0mg  
(4) ゼラチン 3.0mg  
(5) ステアリン酸マグネシウム 2.0mg

上記(1)、(2)および(3)の混合物を10%ゼラチン水溶液0.03mL(ゼラチンとして3.0mg)を用い、1mmメッシュの篩を通して顆粒化した後、40°Cで乾燥した後、再び篩過した。得られた顆粒を上記(5)と混合し、圧縮した。得られた中心錠を蔗糖、二酸化チタン、タルクおよびアラビアガムの水懸液による糖衣でコーティングした。コーティングが施された錠剤をミツロウで艶出してコート錠を得た。

#### 【0127】実験例1

アセチルコリンエステラーゼ阻害活性の測定  
実施例1の結晶のアセチルコリンエステラーゼ阻害活性の測定を、ヒト赤血球由来アセチルコリンエステラーゼを用いて、アセチルチオコリン法(Ellman法)にて行った。ヒト赤血球由来のアセチルコリンエステラーゼ(Sigma社)を蒸留水にて0.2 IU/mLの濃度に溶解し酵素標品とした。96wellマイクロプレートに薬液20μL、80mM Tris-HCl (pH 7.4) 30μL、酵素標品50μLおよび5mM 5,5-dithio-bis(2-nitrobenzoic acid) (Sigma社) 50μLを分注し、10秒間振とうした。50μLの4mM acetylthiocholine iodide (Sigma社)を添加し、再度振とうした直後から10分間30秒間隔で414nmにおける吸光増加を測定した。次式により酵素活性を測定した。

$$R = 5.74 \times 10^{-7} \times \Delta A$$

(式中、Rは酵素活性(mol)、ΔAは414nmの吸光増加を示す)

各化合物について少なくとも3回実験を繰り返し、50%阻害濃度(IC<sub>50</sub>)を求めた。また、上記方法と同様にして、ジスチグミンのアセチルコリンエステラーゼ阻害活性を測定した。結果を下表に示す。

#### 【0128】

化合物 IC<sub>50</sub> (nM)

実施例1 6.6

ジスチグミン 651.9

上記の結果より、本発明の結晶は優れたアセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有することがわかる。

#### 【0129】実験例2

吸湿性試験

実施例1の結晶0.3gを秤量瓶に量り、25°Cで相対湿度(RH)75%(塩化ナトリウムの飽和溶液)およびRH93%(硝酸カリウムの飽和溶液)のデシケータ中で開栓して14日間保存し、その重量変化率を調べた。結果を下表に示す。

#### 【0130】

4	+ 0.11	+ 0.06
7	+ 0.11	+ 0.09
14	+ 0.18	+ 0.15

上記の結果より、本発明の結晶は重量変化がほとんどなく吸湿性が認められないことがわかる。また、各試料の粉末X線解析像はいずれも保存前と同様であり、結晶形の変化は認められなかった。

#### 【0131】実験例3

##### 安定性試験

実施例1の結晶を、以下の各条件下で保存した試料の性状、残存率を調べた。

保存条件	性状	残存率 (%)
1 (60℃/3ヶ月)	白色結晶	99.8
2 (40℃/75%RH, 気密)	白色結晶	101.6
3 (40℃/75%RH, 開栓)	白色結晶	100.2
4 (キセノンランプ/20時間)	白色結晶	100.1

上記の結果より、本発明の結晶は性状の変化、残存率の低下は認められず、安定であることがわかる。また、粉末X線解析像はいずれも保存前と同様であり、結晶形の変化は認められなかった。

#### 【0133】

【発明の効果】本発明の結晶は、優れたアセチルコリンエステラーゼ阻害作用、膀胱排出力改善作用を有し、毒

保存条件：1. 60℃で3ヶ月間（褐色ガラス瓶、気密）；2. 40℃、相対湿度75%で3ヶ月間（褐色ガラス瓶、気密）；3. 40℃、相対湿度75%で3ヶ月間（褐色ガラス瓶、開栓）；4. キセノンランプ下（6万ルクス）で20時間（120万ルクス・h）（ポリ塩化ビニリデン製フィルムで覆ったシャーレ）

結果を下表に示す。

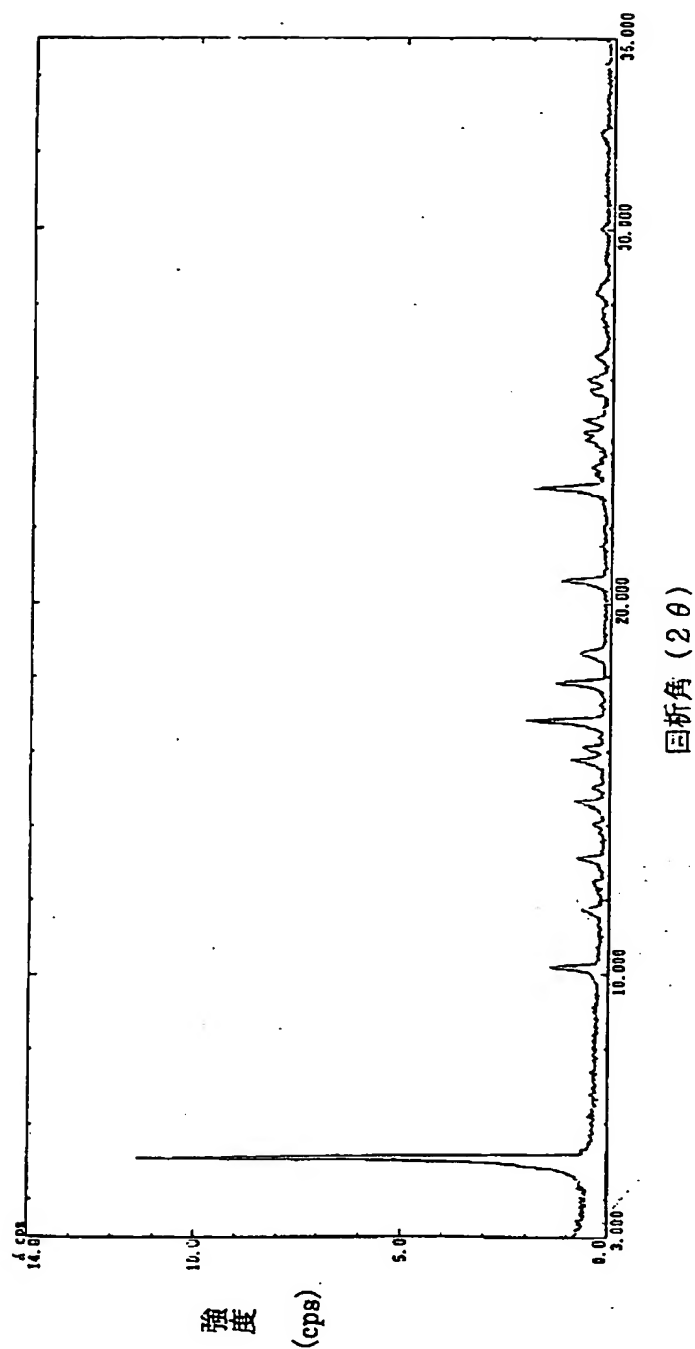
#### 【0132】

性は低く、医薬品として有用である。また、本発明の結晶は、高純度、高品質であり、吸湿性が低く、通常条件下で長期間保存しても変質せず、安定性に極めて優れている。

#### 【図面の簡単な説明】

【図1】実施例1で得られた結晶の粉末X線結晶回析パターンを示す。

【図1】



フロントページの続き

(51)Int.Cl.<sup>7</sup>

A61P 25/28  
43/00

識別記号

111

FI

A61P 25/28  
43/00

(参考)

111

(50) 01-335576 (P2001-335576A)

Fターム(参考) 4C065 AA07 BB04 CC09 DD01 EE02  
HH01 JJ04 KK04 PP03 PP08  
PP13  
4C084 AA19 NA03 NA11 ZA152  
ZA812 ZA832 ZA842 ZC202  
ZC422 ZC752  
4C086 AA01 AA03 CB05 GA15 MA01  
MA02 MA04 NA03 NA11 ZA15  
ZA81 ZA83 ZA84 ZC20 ZC42  
ZC75